

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関
国際事務局



(43)国際公開日
2002年11月28日 (28.11.2002)

PCT

(10)国際公開番号
WO 02/094825 A1

(51)国際特許分類⁷: C07D 471/10, 471/20, 491/107, 491/20, 519/00, A61K 31/438, 31/444, 31/4709, 31/4747, 31/497, 31/506, A61P 1/00, 3/04, 3/06, 3/10, 5/00, 9/00, 9/10, 9/12, 9/14, 11/00, 13/12, 15/00, 25/00, 25/04, 25/08, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 25/32, 27/06, 29/00, 43/00

(SUGA,Takuya) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社つくば研究所内 Ibaraki (JP).

(21)国際出願番号: PCT/JP02/04954

(74)共通の代表者: 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.); 〒103-8416 東京都中央区日本橋本町2丁目2番3号 Tokyo (JP).

(22)国際出願日: 2002年5月22日 (22.05.2002)

(81)指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25)国際出願の言語: 日本語

(84)指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(26)国際公開の言語: 日本語

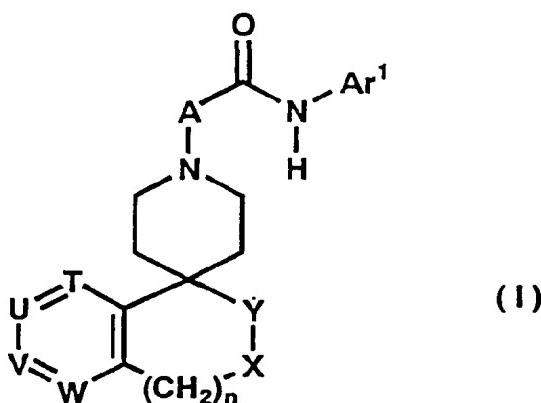
添付公開書類:
— 国際調査報告書

(30)優先権データ:
特願2001-152019 2001年5月22日 (22.05.2001) JP

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドスノート」を参照。

(54)Title: NOVEL SPIROPIPERIDINE DERIVATIVE

(54)発明の名称: 新規スピロピペリジン誘導体



(57)Abstract: A compound represented by the general formula (I): (I) [wherein A means optionally substituted C₁₋₃ linear alkylene; Ar¹ means optionally substituted aryl or heteroaryl; n is 0 or 1; T, U, V, and W each means an optionally substituted methine group or a nitrogen atom, provided that at least two of these mean the methine group; X means a group represented by -N(SO₂R¹)-, -N(COR²)-, or -CO-; and Y means a group represented by -C(R³)(R⁴)-, -O-, or -N(R⁵)-]. The compound has NPY antagonism and is hence useful as a remedy for various diseases in which NPY participates, i.e., circulatory diseases such as hypertension, central diseases such as hyperphagia, metabolic diseases such as obesity and diabetes, sexual and reproductive dysfunction, digestive diseases such as movement disorders of the digestive tract, respiratory diseases, inflammation, glaucoma, etc.

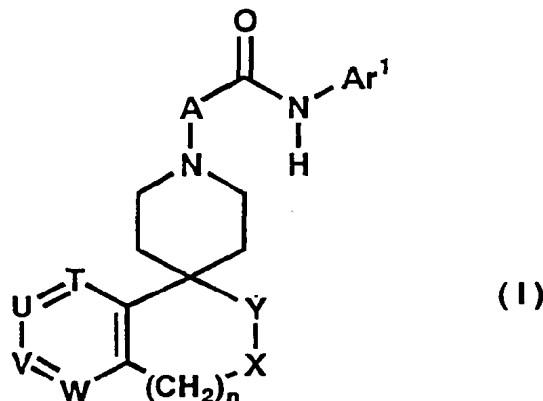
WO 02/094825 A1

[続葉有]



(57) 要約:

本発明は、一般式 (I)



[式中、Aは置換基を有していてもよい炭素数1乃至3の直鎖状アルキレン基を；Ar¹は置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を；nは0又は1を；T、U、V及びWは置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を；Xは—N(SO₂R¹)—、—N(COR²)—、又は—CO—で表される基を；Yは—C(R³)(R⁴)—、—O—、又は—N(R⁵)—で表される基を意味する]で表される化合物等に関する。

本発明の化合物は、NPY拮抗作用を有するため、NPYが関与する各種の疾患、即ち、高血圧等の循環器系疾患、過食症等の中樞性疾患、肥満症、糖尿病等の代謝性疾患、性及び生殖機能障害、消化管運動障害等の消化器系疾患、呼吸器系疾患、炎症又は縲内障等の処置剤として有用である。

明細書

新規スピロピペリジン誘導体

5 技術分野

本発明は医薬の分野において有用である。更に詳しくは、本発明の新規スピロピペリジン誘導体は、神経ペプチドY受容体拮抗物質として、各種の循環器系疾患、中枢神経系疾患、代謝系疾患等の処置剤として有用である。

10 背景技術

神経ペプチドY（以下NPYと称す）は36アミノ酸からなるペプチドであり、1982年、立元らにより豚脳より初めて単離された〔ネイチャー（Nature）、296巻、659頁（1982年）〕。NPYは中枢神経系及び末梢神経系に広く分布し、神経系における最も多量に存在するペプチドの一つとして、
15 生体において多様な機能を司っている。すなわち、NPYは中枢において食欲促進物質として働くとともに、各種ホルモンの分泌又は神経系の作用を介して脂肪蓄積を顕著に促進する。NPYの脳室内連続投与はこれらの作用に基づき、肥満及びインスリン抵抗性を誘発することが知られている〔インターナショナル・ジャーナル・オブ・オベシティ（International Journal of Obesity）、19巻、517頁（1995年）；エンドocrinology）、133巻、1753頁（1993年）〕。
20 また、その他、うつ病、不安、精神分裂、痛み、痴呆及び概日リズムの調節などの中枢作用を持つことが知られている〔ドラッグス（Drugs）、52巻、371頁（1996）；ザ・ジャーナル・オブ・ニュウロサイエンス（The Journal of Neuroscience）、18巻、3014頁（1998年）〕。更に、末梢では、NPYは交感神経終末にノルエピネフリンと共に存し、交感神経系の緊張性と関係している。NPYの末梢投与は血管収縮を引き起こし、またノルエピネフリンをはじめとする他の血管収縮物質の作用を増強するこ

5 とが知られている〔ブリティッシュ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー（British Journal of Pharmacology）、95巻、419頁（1988年）〕。更に交感神経系の亢進にともなう心肥大を助長することも報告されている〔プロシーディング・ナショナル・アカデミック・サイエンス・ユースエー（Proceeding National Academic Science USA）、97巻、1595頁（2000）〕。

10 その他、性ホルモン及び成長ホルモンの分泌能、性及び生殖機能、消化管運動、気管支収縮、炎症及びアルコールに対する嗜好性への関与も報告されている〔ライフ・サイエンス（Life Science）、55巻、551頁（1994年）；ザ・ジャーナル・オブ・アレルギー・アンド・クリニカル・イムノロジー（The Journal of Allergy and Immunology）、101巻、S345頁（1998年）；ネイチャー（Nature）、396巻、366頁（1998年）〕。

15 NPYは、その類縁体であるペプタイドYY及びパンクレアティック・ポリペプタイドと一部共通の受容体を介して、多種多様な薬理作用を有する。これらNPYによる薬理作用は少なくとも5種類の受容体の単独あるいは相互作用を介して惹起されることが知られている〔トレンド・イン・ニューロサイエンス（Trends in Neuroscience）、20巻、294頁（1997年）〕。

20 NPY Y1受容体を介する中枢作用としては、顕著な食欲促進作用が報告されている〔エンドocrinology（Endocrinology）、137巻、3177頁（1996年）；エンドocrinology（Endocrinology）、141巻、1011頁（2000年）〕。更に不安感や痛みへの関与も報告されている〔ネイチャー（Nature）、259巻、528頁（1993年）；ブレイン・リサーチ（Brain Research）、859巻、361頁（2000年）〕。また、末梢においては強力な血管収縮作用を介した血圧上昇作用が報告されている〔フェブス・レター（FEBS Letters）、362巻、192頁、（1995年）；ネイチャー・メディシン（Nature Medicine）、4巻、722頁（1998年）〕。

NPY Y2受容体を介する作用としては、神経終末において各種神経伝達物質の放出を阻害することが知られている〔ブリティッシュ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー (British Journal of Pharmacology)、102巻、41頁(1991年)：シナプス (Synapse) 2巻5、299頁(1988年)〕。また、末梢においては、これら神経伝達物質の制御あるいは直接の作用として、血管又は輸精管の収縮に関与する〔ザ・ジャーナル・オブ・ファルマコロジー・アンド・エクスペリメンタル・セラピューティクス (The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics)、261巻、863頁(1992年)；ブリティッシュ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー (British Journal of Pharmacology)、100巻、190頁(1990年)〕。また、脂肪組織においては、脂肪分解作用の抑制が知られている〔エンドocrinology (Endocrinology)、131巻、1970頁(1992年)〕。更に消化管においては、イオン分泌を阻害することが報告されている〔ブリティッシュ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー (British Journal of Pharmacology)、101巻、247頁(1990年)〕。一方、記憶及び不安感等の中枢作用も知られている〔ブレイン・リサーチ (Brain Research)、503巻、73頁(1989年)：ペプタイド (Peptides)、19巻、359頁(1998年20)〕。

NPY Y3受容体は、主に脳幹及び心臓に発現しており、血圧、心拍数の制御に関与していることが報告されている〔ザ・ジャーナル・オブ・ファルマコロジー・アンド・エクスペリメンタル・セラピューティクス (The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics)、258巻、633頁(1991年)；ペプタイド (Peptides)、11巻、545頁(1990年)〕。更に、副腎においてはカテコールアミンの分泌に関与することが知られている〔ザ・ジャーナル・オブ・ファルマコロジー・アンド・エクスペリメンタル・セラピューティクス (The Journal of Pharmacology and Expe

ri mental Therapeutics)、244巻、468頁(1988年)；ライフ・サイエンス(Life Science)、50巻、PL7頁(1992年)]。

NPY Y4受容体は特にパンクレアティック・ポリペプタイドとの親和性が高く、薬理作用としては、膵外分泌及び消化管運動の抑制が報告されている[ガストロエンテロロジー(Gastroenterology)、85巻、1411頁(1983年)]。更に中枢においては、性ホルモンの分泌を促進することが知られている[エンドクリノロジー(Endocrinology)、140巻、5171頁(1999年)]。

NPY Y5受容体を介する作用としては、食欲促進効果を含む脂肪蓄積作用が顕著である[ネイチャー(Nature)、382巻、168頁(1996年)；アメリカン・ジャーナル・オブ・フィジオロジー(American Journal of Physiology)、277巻、R1428頁(1999年)]。また、痙攣及びてんかんへの関与又は痛み及びモルヒネ投与の中止に伴う禁断症状への関与更に概日リズムの調節等の中枢作用が報告されている[ネイチャー・メディシン(Nature Medicine)、3巻、761頁(1997年)；Proceeding National Academic Science USA)、96巻、13518頁(1999年)；ザ・ジャーナル・オブ・ファルマコロジー・アンド・エクスペリメンタル・セラピューティクス(The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics)、284巻、633頁(1998年)；ザ・ジャーナル・オブ・ニュウロサイエンス(The Journal of Neuroscience)、21巻、5367頁(2001年)]。更に末梢においては、利尿作用及び血糖降下作用が報告されている[ブリティッシュ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー(British Journal of Pharmacology)、120巻、1335頁(1998年)；エンドクリノロジー(Endocrinology)、139巻、3018頁(1998年)]。更に交感神経系の亢進にともなう心肥大を助長することも報

告されている〔 Proceeding National Academic Science USA 〕、97巻、1595頁(2000)〕。

NPYの機能は中枢又は末梢神経系に存在するNPY受容体を結合することにより発現される。したがって、NPYのNPY受容体との結合を阻害すれば、NPYの作用発現を阻止することができる。その結果、NPYのNPY受容体結合に拮抗する物質はNPYが関与する各種疾患、例えば高血圧、腎臓病、心疾患、血管れん縮等の循環器系疾患、例えば過食症、うつ病、不安、痙攣、てんかん、痴呆、痛み、アルコール依存症、薬物の断薬に伴う禁断症状、概日リズムの変調、精神分裂病(統合失調症)等の中核性疾患、例えば肥満症、糖尿病、ホルモン異常等の代謝性疾患、性及び生殖機能障害、消化管運動障害、呼吸器系疾患、炎症又は緑内障等の予防又は治療における有用性が期待できる〔 Trends in Pharmaceutical Science 〕、15巻、153頁(1994年)； Life Science 〕、55巻、551頁(1994年)； Drugs 〕、52巻、371頁(1996年)； The Journal of Allergy and Immunology 〕、101巻、S345頁(1998年)； Nature 〕、396巻、366頁(1998年)； The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics 〕、284巻、633頁(1998年)； Trends in Pharmacological Science 〕、20巻、104頁(1999年)； Proceeding National Academic Science USA 〕、97巻、1595頁(2000)； The Journal of Neuroscience 〕、21巻、5367頁(2001年)

; ファルマコロジー・アンド・セラピューティクス (Pharmacology & Therapeutics)、65巻、397頁(1995年)]。

また、最近、本発明者らの研究により、ある種のNPY受容体拮抗物質が、高コレステロール血症、高脂血症、動脈硬化症の予防又は治療において有用であることが見出された (国際公開WO 99/27965号; WO 00/27845号; WO 01/14376号)。

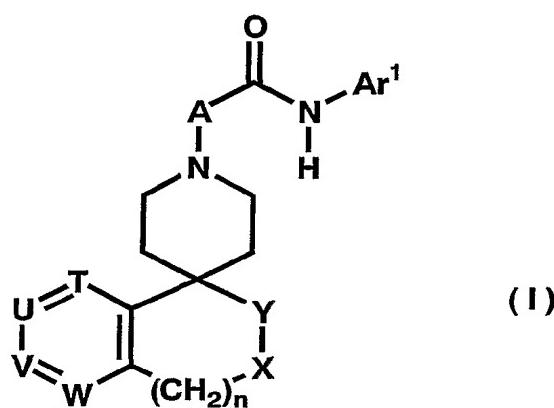
本発明の化合物と構造的に関連する化合物としては、国際公開WO 98/35957号にアミド誘導体およびNPY拮抗作用について開示されている。しかしながら、この刊行物に本発明の化合物は何ら具体的に開示も示唆もされていない。

10

発明の開示

本発明の目的は、NPY拮抗作用を有する新規な薬剤を提供することにある。

本発明者らは、一般式(I)



15 [式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し; Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し; Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ

基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有してもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；nは0又は1を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R¹は低級アルキル基、アラルキル基又5はアリール基を意味し；R²及びR⁵は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R³及びR⁴は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有してもよい10メチル基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチル基を意味し；Xは-N(SO₂R¹)-、-N(COR²)-又は-CO-で表される基を意味し；Yは-C(R³)(R⁴)-、-O-又は-N(R⁵)-で表される基を意味する】で表される化合物がNPY拮抗作用を有し、NPYが関与する各種の疾患の処置剤として有用であることを見出し、本発明を完成した。

15 本発明化合物（I）は、NPYが関与する各種の疾患、すなわち、例えば高血圧、腎臓病、心疾患、血管れん縮、動脈硬化症等の循環器系疾患、例えば過食症、うつ病、不安、痙攣、てんかん、痴呆、痛み、アルコール依存症、薬物の断薬に伴う禁断症状、概日リズムの変調、精神分裂病（統合失調症）等の中樞性疾患、例えば肥満症、糖尿病、ホルモン異常、高コレステロール血症、高脂血症等の代20謝性疾患、性及び生殖機能障害、例えば消化管運動障害等の消化器系疾患、呼吸器系疾患、炎症又は緑内障等の処置剤として有用である。

特に、本発明化合物（I）は、例えば過食症、肥満症、糖尿病等の処置剤として有用である。

25 本発明は、一般式（I）で表される化合物、その塩又はエステル並びにそれらの製造法及び用途に関する。

以下に、本明細書において用いられる用語の意味を記載し、本発明について更に詳細に説明する。

「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子を意味する。

「低級アルキル基」とは、炭素数1ないし6の直鎖状又は分岐状のアルキル基を意味し、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基等が挙げられる。

- 5 「アリール基」とは、炭素数6ないし16の芳香族性を有する環式炭化水素及びその誘導体から形成される基を意味し、例えばフェニル基、トリル基、キシリル基、メシチル基、クメニル基、ナフチル基、アントリル基、フェナントリル基、ピレニル基、インダニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル基、アセナフテニル基、フルオレニル基等が挙げられる。
- 10 「アラルキル基」とは、置換可能な任意の位置が1又は2以上、好ましくは1の前記アリール基で置換された前記低級アルキル基を意味し、例えばベンジル基、1-フェニルエチル基、フェネチル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基等が挙げられる。

- 15 「炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基」とは、メチレン基、エチレン基、トリメチレン基を意味する。

- 「ハロ低級アルキル基」とは、置換可能な任意の位置が1又は2以上、好ましくは1ないし3の同一又は異なる前記ハロゲン原子で置換された前記低級アルキル基を意味し、例えばフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2-フルオロエチル基、1, 2-ジフルオロエチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、1, 2-ジクロロエチル基、ブロモメチル基、ヨードメチル基等が挙げられる。

- 20 「ヒドロキシ低級アルキル基」とは、置換可能な任意の位置が1又は2以上、好ましくは1又は2の水酸基で置換された前記低級アルキル基を意味し、例えばヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル基、1, 2-ジヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基等が挙げられる。

25 「シクロ低級アルキル基」とは、炭素数3ないし6のシクロアルキル基を意味し、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基が挙げられる。

「低級アルケニル基」とは、炭素数2ないし6の直鎖又は分岐状のアルケニル基を意味し、例えばビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、イソプロペニル基、3-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、1-メチル-1-プロペニル基、1-エチル-1-エテニル基、
5 2-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基、3-メチル-2-ブテニル基、4-ペンテニル基等が挙げられる。

「低級アルコキシ基」とは、炭素数1ないし6の直鎖状又は分岐状のアルコキシ基を意味し、例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、sec-ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基、
10 ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基等が挙げられる。

「ハロ低級アルコキシ基」とは、置換可能な任意の位置が1又は2以上、好ましくは1ないし3の同一又は異なる前記ハロゲン原子で置換された前記低級アルコキシ基を意味し、例えばフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、1, 2-ジフルオロエトキシ基、クロロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、1, 2-ジクロロエトキシ基、ブロモメトキシ基、ヨードメトキシ基等が挙げられる。

「低級アルキルチオ基」とは、炭素数1ないし6の直鎖状又は分岐状のアルキルチオ基を意味し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、イソブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、ペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基等が挙げられる。

「低級アルカノイル基」とは、前記低級アルキル基を有するアルカノイル基、すなわち、炭素数2ないし7のアルカノイル基を意味し、例えばアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、イソバレリル基、ピバロイル基等が挙げられる。

「低級アルコキカルボニル基」とは、前記低級アルコキシ基を有するアルコキカルボニル基、すなわち、炭素数2ないし7のアルコキカルボニル基を意味し、例えばメトキカルボニル基、エトキカルボニル基、プロポキカルボ

ニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、*t e r t*-ブトキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基等が挙げられる。

「ヘテロアリール基」とは、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子からなる群より、同一若しくは異なって選ばれる 1 若しくは 2 以上、好ましくは 1 ないし 3 の複素原子を含有する 5 員若しくは 6 員の単環式芳香族複素環基又は該単環式芳香族複素環基と前記アリール基が縮合した、若しくは同一若しくは異なる該単環式芳香族複素環基が互いに縮合した縮合環式芳香族複素環基を意味し、例えばピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、オキサジアゾリル基、1, 2, 3-チアジアゾリル基、1, 2, 4-チアジアゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 2, 4-トリアジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、インドリル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基、インダゾリル基、プリニル基、キノリル基、イソキノリル基、フタラジニル基、ナフチリジニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、シンノリニル基、プテリジニル基、1, 5-ナフチリジニル基等が挙げられる。

「低級アルキルアミノ基」とは、前記低級アルキル基でモノ置換されたアミノ基を意味し、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、*s e c*-ブチルアミノ基、*t e r t*-ブチルアミノ基等が挙げられる。

「ジ低級アルキルアミノ基」とは、同一又は異なる前記低級アルキル基でジ置換されたアミノ基を意味し、例えばジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、メチルプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基等が挙げられる。

一般式 (I) で表される化合物の「塩」とは、医薬として許容されうる慣用的なものを意味し、例えばカルボキシル基を有する場合の当該カルボキシル基にお

ける塩基付加塩又はアミノ基若しくは塩基性の複素環基を有する場合の当該塩基性複素環基における酸付加塩の塩類を挙げることができる。

該塩基付加塩としては、例えばナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩；例えばカルシウム塩、マグネシウム塩等のアルカリ土類金属塩；例えばアンモニウム塩；例えばトリメチルアミン塩、トリエチルアミン塩、ジシクロヘキシリジン塩、エタノールアミン塩、ジエタノールアミン塩、トリエタノールアミン塩、プロカイン塩、N, N' -ジベンジルエチレンジアミン塩等の有機アミン塩等が挙げられる。

該酸付加塩としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩、過塩素酸塩等の無機酸塩；例えばマレイン酸塩、フマール酸塩、酒石酸塩、クエン酸塩、アスコルビン酸塩、トリフルオロ酢酸塩等の有機酸塩；例えばメタンスルホン酸塩、イセチオン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩等のスルホン酸塩等が挙げられる。

一般式（I）で表される化合物の「エステル」としては、例えばカルボキシリジン基を有する場合の当該カルボキシリジン基における医薬として許容されうる慣用的なものを意味し、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基等の低級アルキル基とのエステル、ベンジル基、フェネチル基等のアラルキル基とのエステル、アリル基、2-ブテニル基等の低級アルケニル基とのエステル、メトキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基等の低級アルコキシ低級アルキル基とのエステル、アセトキシメチル基、ピバロイルオキシメチル基、1-ピバロイルオキシエチル基等の低級アルカノイルオキシ低級アルキル基とのエステル、メトキシカルボニルメチル基、イソプロポキシカルボニルメチル基等の低級アルコキシカルボニル低級アルキル基とのエステル、カルボキシメチル基等のカルボキシ低級アルキル基とのエステル、1-(エトキシカルボニルオキシ)エチル基、1-(シクロヘキシリオキシカルボニルオキシ)エチル基等の低級アルコキシカルボニルオキシ低級アルキル基とのエステル、カルバモイルオキシメチル基等のカルバモイルオキシ低級アルキル基とのエステル、フタリジル基と

のエステル、(5-メチル-2-オキソ-1, 3-ジオキソール-4-イル)メチル基等の(5-置換-2-オキソ-1, 3-ジオキソール-4-イル)メチル基とのエステル等が挙げられる。

「処置剤」とは、各種疾患に対して治療及び／又は予防の目的で供せられる薬剤を意味する。

前記一般式(I)で表される本発明の化合物を更に具体的に開示するため、式(I)において用いられる各種記号につき、その好適な具体例を挙げて更に詳細に説明する。

Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味する。

「低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基」とは、無置換の前記炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基、又は置換可能な任意の位置に置換基を有する前記炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し、該置換基は低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より、同一又は異なって1又は2以上、好ましくは1又は2選択することができる。

該置換基の低級アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基等が好適である。

該置換基のアラルキル基としては、例えばベンジル基、フェネチル基等が好適である。

該置換基のアリール基としては、例えばフェニル基等が好適である。

該置換基としては、例えば低級アルキル基等が好適である。

Aの炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基としては、例えばメチレン基、エチレン基等、より好ましくはメチレン基等が好適である。

したがって、Aとしては、具体的には、例えばメチレン基、エチレン基、トリメチレン基、エチリデン基、プロピリデン基、イソプロピリデン基、ベンジリデン基、フェネチリデン基、1-メチルエチレン基、1, 2-ジメチルエチレン基等が挙げられ、中でもメチレン基、エチレン基、エチリデン基等、より好ましくはメチレン基等が好適である。

A_r^1 はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシリ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び $-Q-A_r^2$ で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味する。

「ハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシリ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び $-Q-A_r^2$ で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基」とは、無置換の前記アリール基若しくは前記ヘテロアリール基、又は置換可能な任意の位置に置換基を有する前記アリール基若しくは前記ヘテロアリール基を意味し、該置換基はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシリ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び $-Q-A_r^2$ で表される基からなる群より、同一又は異なって1又は2以上、好ましくは1又は2選択することができる。

該置換基のハロゲン原子としては、例えばフッ素原子、塩素原子等が好適である。

該置換基の低級アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基等が好適である。

該置換基のハロ低級アルキル基としては、例えばジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基等が好適である。

該置換基のヒドロキシ低級アルキル基としては、例えばヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル基等が好適である。

該置換基のシクロ低級アルキル基としては、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基等が好適である。

該置換基の低級アルケニル基としては、例えばビニル基、1-プロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基等が好適である。

該置換基の低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ基、エトキシ基等が好適である。

5 該置換基のハロ低級アルコキシ基としては、例えばフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基等が好適である。

該置換基の低級アルキルチオ基としては、例えばメチルチオ基、エチルチオ基等が好適である。

10 該置換基の低級アルカノイル基としては、例えばアセチル基、プロピオニル基等が好適である。

該置換基の低級アルコキカルボニル基としては、例えばメトキカルボニル基、エトキカルボニル基等が好適である。

15 該置換基の $-Q-Ar^2$ で表される基において、 Ar^2 はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味する。

「ハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基」とは、無置換の前記アリール基若しくは前記ヘテロアリール基、又は置換可能な任意の位置に置換基を有する前記アリール基若しくは前記ヘテロアリール基を意味し、該置換基はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より、同一又は異なって1又は2以上、好ましくは1又は2選択することができる。

該置換基のハロゲン原子としては、例えばフッ素原子、塩素原子等が好適である。

該置換基の低級アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基等が好適である。

- 5 該置換基のハロ低級アルキル基としては、例えばジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基等が好適である。

該置換基のヒドロキシ低級アルキル基としては、例えばヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル基等が好適である。

- 10 該置換基の低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ基、エトキシ基等が好適である。

該置換基のハロ低級アルコキシ基としては、例えばフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基等が好適である。

該置換基の低級アルキルアミノ基としては、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基等が好適である。

- 15 該置換基のジ低級アルキルアミノ基としては、例えばジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等が好適である。

該置換基の低級アルカノイル基としては、例えばアセチル基、プロピオニル基等が好適である。

該置換基のアリール基としては、例えばフェニル基等が好適である。

- 20 $A r^2$ の置換基としては、例えばハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、ハロ低級アルコキシ基等が好適である。

- 25 $A r^2$ のアリール基としては、例えばフェニル基等が、ヘテロアリール基としては、例えばイミダゾリル基、ピリジル基、ベンゾフラニル基、キノリル基等が好適である。

したがって、 $-Q-A r^2$ で表される基としては、例えばフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニ

ル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、
 2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロー-5-メチルフェニル基、3-フルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-フルオロー-5-メトキシフェニル基、3-フルオロメトキシフェニル基、3-ジフルオロメトキシフェニル基、3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル基、3-ヒドロキシフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、2-イミダゾリル基、1-メチル-2-イミダゾリル基、1-エチル-2-イミダゾリル基、2-チアゾリル基、2-エチル-4-チアゾリル基、1,2,4-チアジアゾール-5-イル基、1,3,4-チアジアゾール-2-イル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-エチル-4-ピリジル基、5-メトキシ-3-ピリジル基、4-ピリミジニル基、5-ピリミジニル基、4-ベンゾ[b]フラニル基、5-ベンゾ[b]フラニル基、7-ベンゾ[b]フラニル基、2-キノリル基、3-キノリル基、4-キノリル基、5-キノリル基、6-キノリル基、8-キノリル基、ベンゾイル基、2-ピリジルカルボニル基等が挙げられ、中でもフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3-シアノフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、3-ジフルオロメトキシフェニル基、3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル基、3-ヒドロキシフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、1-エチル-2-イミダゾリル基、2-ピリジル基、7-ベンゾ[b]フラニル基、2-キノリル基、3-キノリル基、ベンゾイル基、2-ピリジルカルボニル基等、より好ましくはフェニル基、ベンゾイル基等が好適である。

$A r^1$ の置換基としては、例えばハロゲン原子、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、低級アルカノイル基、 $-Q-A r^2$ で表される基等、より好ましくは、ハロゲン原子、オキソ基、低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルカノイル基、 $-Q-A r^2$ で表さ

れる基等が好適である。

A_r¹のアリール基としては、例えばフェニル基、ナフチル基、フルオレニル基等、より好ましくはフェニル基等が、ヘテロアリール基としては、例えばイミダゾリル基、ピラゾリル基、チアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、1, 2, 4-チアジアゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、1, 2, 4-トリアジニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ピリド[3, 2-d]チアゾリル基、キノリル基、キノキサリニル基、1, 5-ナフチリジニル基等が好適である。

したがって、A_r¹としては、例えば3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、4-アセチルフェニル基、5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル基、4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-ビフェニリル基、3-ビフェニリル基、4-ビフェニリル基、4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル基、4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル基、4-(2-チアゾリル)フェニル基、4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル基、3-(2-ピリジル)フェニル基、3-(4-ピリジル)フェニル基、4-(2-ピリジル)フェニル基、4-(3-ピリジル)フェニル基、4-(4-ピリジル)フェニル基、4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル基、4-(4-ピリミジニル)フェニル基、4-ベンゾイルフェニル基、4-(2-ピリジカルボニル)フェニル基、1-ナフチル基、9-オキソ-3-フルオレニル基、1-メチル-2-イミダゾリル基、1-フェニル-4-イミダゾリル基、1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-トリフルオロメチルフェ

ニル) -4-イミダゾリル基、1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル基、1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル基、1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル基、1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル基、1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル基、1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル基、1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル基、
 10 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル基、1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル基、1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル基、1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル基、1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル基、1-フェニル-3-ピラゾリル基、5-フェニル-3-ピラゾリル基、5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル基、5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラ
 15 ゾリル基、5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル基、5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル基、5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル基、5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル基、5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル基、5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル基、5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル基、
 20 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル基、5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル基、5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル基、5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル基、5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル基、2-エチル-4-チアゾリル基、4-フェニル-2-チアゾリル基、5-フェニル-2-チアゾリル基、5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル基、5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル基、5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル基、5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル基、4-フェニル-2-オキサゾリル基、5-フェニル-2-オキサゾリル基、4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル基、4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル基、4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル

基、3-フェニル-5-イソオキサゾリル基、3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル基、3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル基、3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル基、3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル基、5-フェニル-1,2,4-チアジアゾール-3-イル基、5-フェニル-1,3,4-チアジアゾール-2-イル基、5-(3-クロロフェニル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル基、5-(2-ピリジル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル基、5-(2-エチル-4-ピリジル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル基、5-フェニル-2-ピリジル基、5-フェニル-3-ピリジル基、6-フェニル-3-ピリジル基、2-フェニル-4-ピリジル基、5-(2-ピリジル)-2-ピリジル基、5-ベンゾイル-2-ピリジル基、6-ベンゾイル-3-ピリジル基、5-クロロ-2-ピラジニル基、5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル基、5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル基、5-アセチル-2-ピラジニル基、5-プロピオニル-2-ピラジニル基、5-フェニル-2-ピラジニル基、5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル基、5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル基、5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル基、5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル基、5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル基、5-(1,2,4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル基、5-(1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル基、5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル基、5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル基、5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル基、5-(3-キノリル)-2-ピラジニル基、5-ベンゾイル-2-ピラジニル基、5-(2-ピリジルカルボニル)-2-ピラジニル基、5-アセチル-2-ピリミジニル基、5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル基、4-フェニル-2-ピリミジニル基、5-フェニル-2-ピリミジニル基、2-フェニル-4-ピリミジニル基、6-フェニル-4-ピリミジニル基、2-フェニル-5-ピリミジニル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-クロロフ

エニル) -2-ピリミジニル基、5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、6-フェニル-3-ピリダジニル基、6-フェニル-1,2,4-トリアジン-3-イル基、5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル基、4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル基、2-ベンゾチアゾリル基、5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル基、4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル基、6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル基、4-メチル-2-ベンゾチアゾリル基、2-メチル-5-ベンゾチアゾリル基、4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル基、5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル基、6-メトキシピリド[3,2-d]チアゾール-2-イル基、3-キノリル基、6-キノリル基、6-メチル-2-キノリル基、7-メチル-2-キノリル基、8-メチル-2-キノリル基、2-メチル-6-キノリル基、6-クロロ-2-キノキサリニル基、7-クロロ-2-キノキサリニル基、6-メチル-2-キノキサリニル基、1,5-ナフチリジン-2-イル基、7-クロロ-1,5-ナフチリジン-2-イル基、7-メチル-1,5-ナフチリジン-2-イル基、7-トリフルオロメチル-1,5-ナフチリジン-2-イル基、7-ジフルオロメトキシ-1,5-ナフチリジン-2-イル基、7-アセチル-1,5-ナ

フチリジン-2-イル基等が挙げられ、中でも3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、4-アセチルフェニル基、5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル基、4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-ビフェニリル基、3-ビフェニリル基、4-ビフェニリル基、4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル基、4-ベンゾイルフェニル基、4-(2-ピリジルカルボニル)フェニル基、1-ナフチル基、9-オキソ-3-フルオレニル基、1-フェニル-4-イミダゾリル基、1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル基、1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル基、1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル基、1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル基、1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル基、1-フェニル-3-ピラゾリル基、5-フェニル-3-ピラゾリル基、5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル基、5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル基、4-フェニル-2-チアゾリル基、5-フェニル-2-チアゾリル基、3-フェニル-5-イソオキサゾリル基、5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル基、5-フェニル-3-ピリジル基、2-フェニル-4-ピリジル基、5-ベンゾイル-2-ピリジル基、5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル基、5-フェニル-2-ピラジニル基、5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル基、5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル基、5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル基、5-ベンゾイル-2-ピラジニル基、4-フェニル-2-ピリミジニル基、5-フェニル-2-ピリミジニル基、2-フェニル-4-ピリミジニル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル基、2-ベンゾチアゾリル基、4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル基、6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル基、4-メチル-2-ベ

ンゾチアゾリル基、6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル基、6-メチル-2-キノリル基、7-メチル-2-キノリル基、7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル基等が好適である。

nは0又は1を意味するが、0が好適である。

5 T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチル基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチル基を意味する。

10 「ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチル基」とは、無置換のメチル基又は置換基を有するメチル基を意味し、該置換基はハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択することができる。

該置換基のハロゲン原子としては、例えばフッ素原子、塩素原子等が好適である。

15 該置換基の低級アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基等が好適である。

該置換基の低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ基、エトキシ基等が好適である。

該置換基としては、例えばハロゲン原子等が好適である。

20 T、U、V及びWの好ましい態様としては、例えば、T、U、V及びWが、それぞれ独立して、前記置換基、より好ましくはハロゲン原子を有していてもよいメチル基であるとき；又はT、U、V及びWのいずれか1つが窒素原子であるとき等が挙げられる。

Xは-N(SO₂R¹)-、-N(COR²)-又は-CO-で表される基を意味し；Yは-C(R³)(R⁴)-、-O-又は-N(R⁵)-で表される基を意味し；R¹は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R²及びR⁵は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R³及びR⁴は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味する。

R¹、R²、R³、R⁴及びR⁵の低級アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基等、より好ましくはメチル基等が好適である。

R¹、R²、R³、R⁴及びR⁵のアラルキル基としては、例えばベンジル基等が好適である。

5 R¹、R²、R³、R⁴及びR⁵のアリール基としては、例えばフェニル基等が好適である。

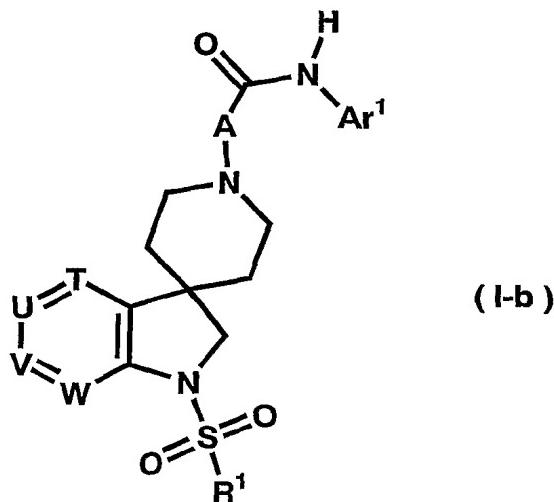
R¹及びR²としては、例えば低級アルキル基等が好適である。

R³及びR⁴の好ましい態様としては、例えば、R³及びR⁴がともに水素原子であるとき等が挙げられる。

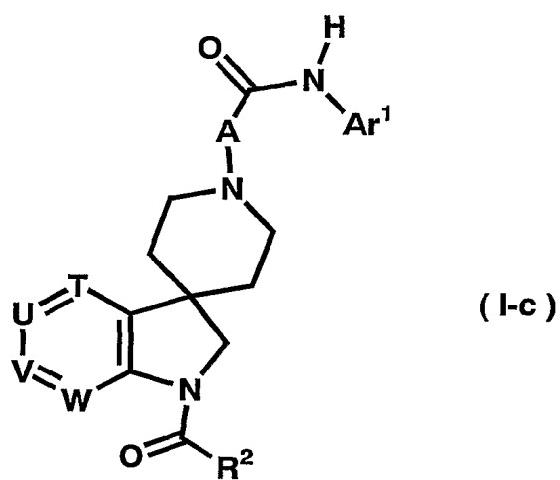
10 R⁵としては、例えば水素原子、低級アルキル基等、より好ましくは水素原子等が好適である。

X、Y及びnの好ましい態様としては、例えば、Xが-N(SO₂R¹)—若しくは-N(COR²)—で表される基、より好ましくは-N(SO₂R¹)—で表される基であり、nが0であり、かつYが-C(R³)(R⁴)—で表される基であるときか、又はXが-CO—で表される基であり、かつYが-O—若しくは-N(R⁵)—で表される基、より好ましくは-O—で表される基であるとき等が挙げられる。

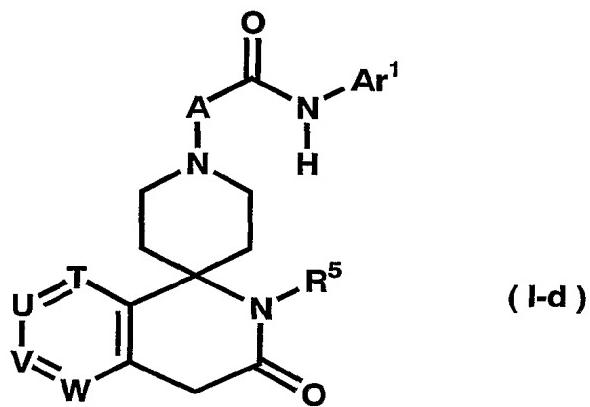
一般式 (I-b)



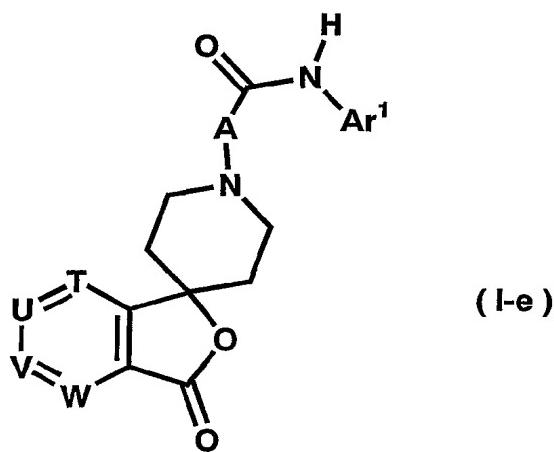
20 [式中、A、Ar¹、R¹、T、U、V及びWは前記の意味を有する] で表される化合物、一般式 (I-c)



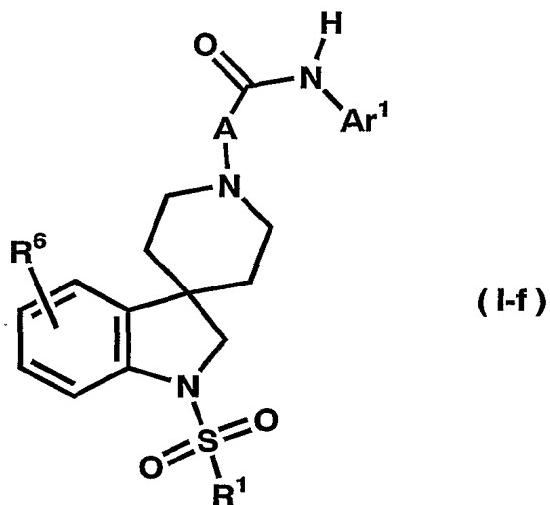
[式中、A、Ar¹、R²、T、U、V及びWは前記の意味を有する] で表される化合物、一般式 (I - d)



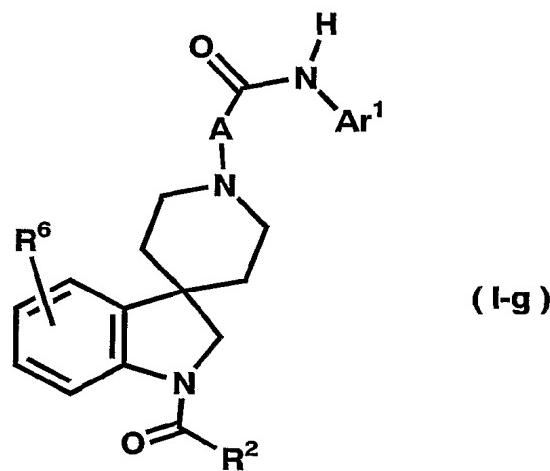
5 [式中、A、Ar¹、R⁵、T、U、V及びWは前記の意味を有する] で表される化合物、一般式 (I - e)



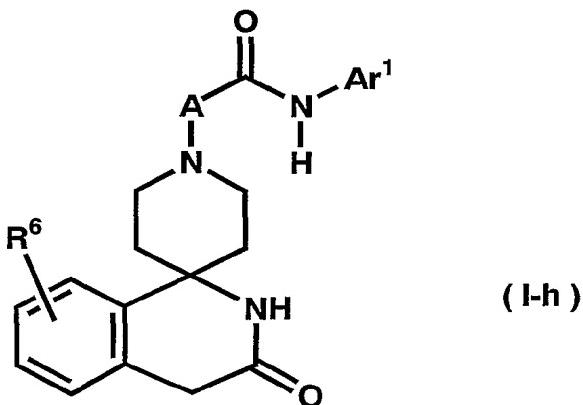
[式中、A、Ar¹、T、U、V及びWは前記の意味を有する] で表される化合物、一般式 (I - f)



[式中、R¹は水素原子又はハロゲン原子を意味し、A、Ar¹及びR¹は前記の意味を有する]で表される化合物、一般式(I-g)

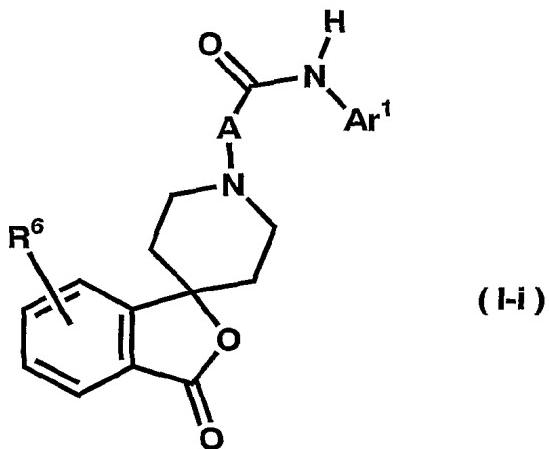


5 [式中、A、Ar¹、R²及びR⁶は前記の意味を有する]で表される化合物、一般式(I-h)



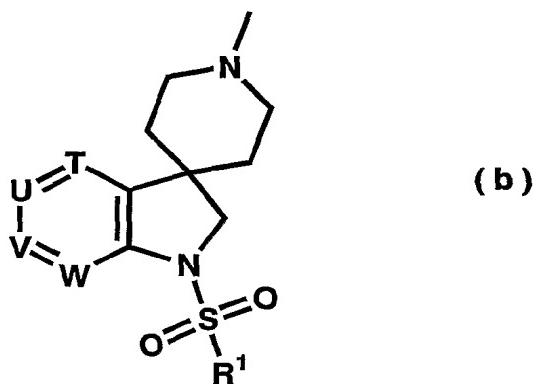
[式中、A、Ar¹及びR⁶は前記の意味を有する]で表される化合物及び一般式

(I - i)

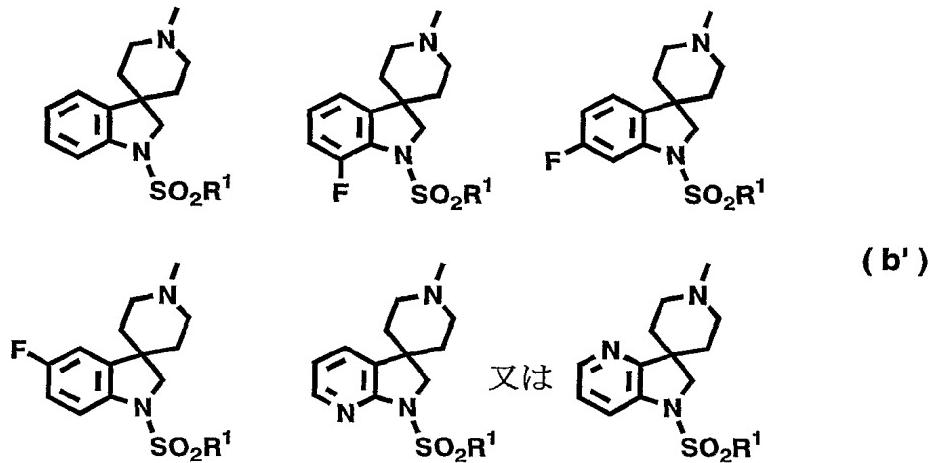


[式中、A、Ar¹及びR⁶は前記の意味を有する]で表される化合物は一般式(I)で表される化合物に包含される。

5 式 (b)

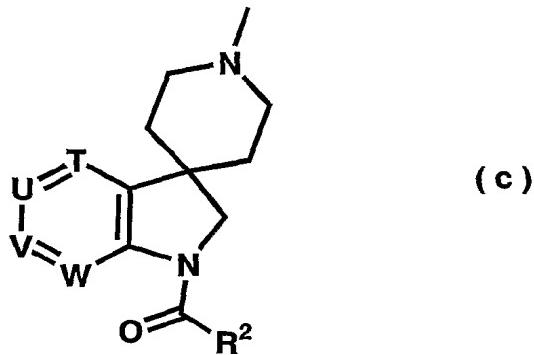


で表される基の具体例としては、例えば、次の式(b')

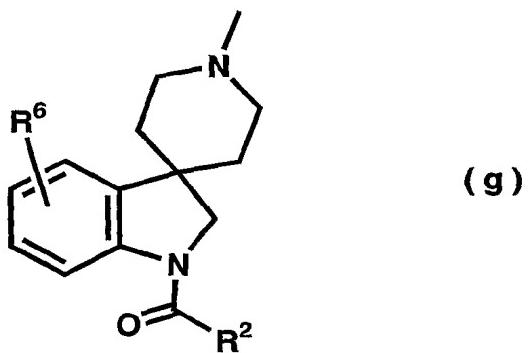


[式中、R¹は前記の意味を有する]で表される基等が挙げられる。

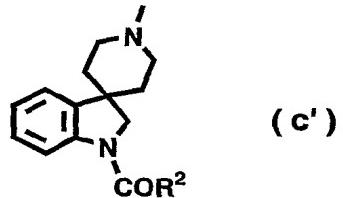
式 (c)



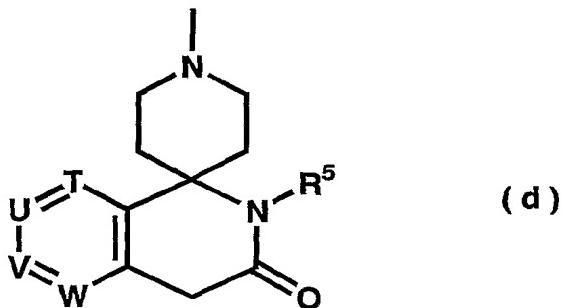
で表される基又は式 (g)



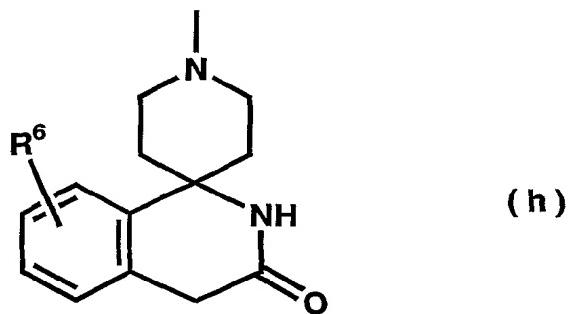
5 で表される基の具体例としては、例えば、次の式 (c')

[式中、R²は前記の意味を有する] で表される基等が挙げられる。

式 (d)

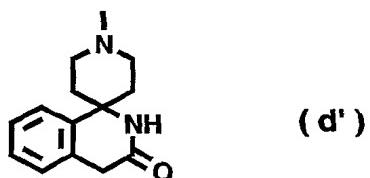


10 で表される基又は式 (h)



(h)

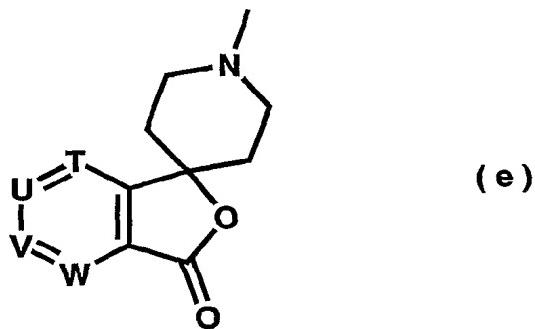
で表される基の具体例としては、例えば、次の式（d'）



(d')

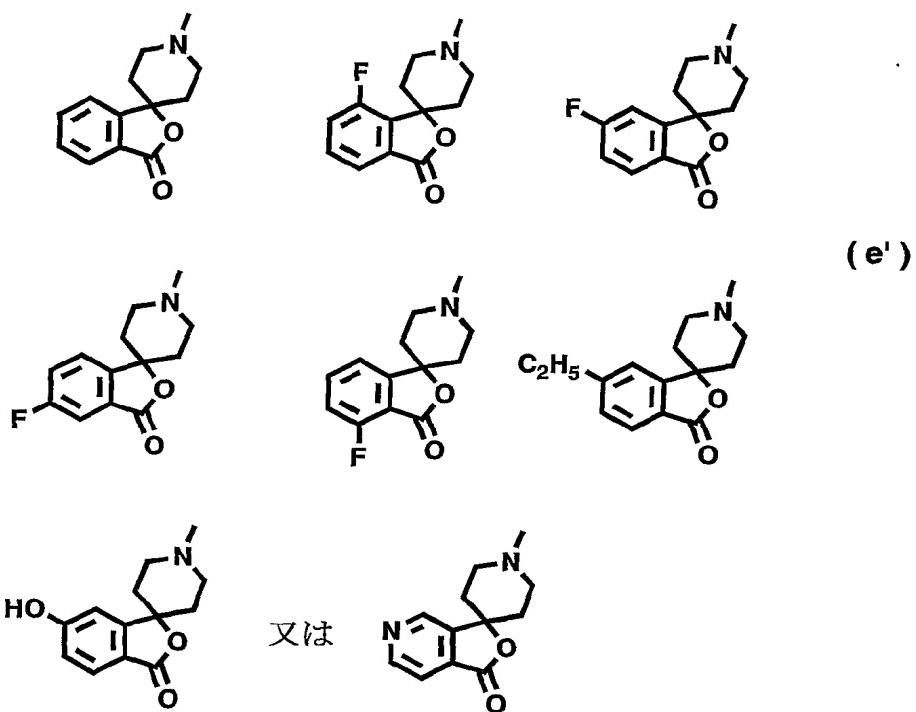
で表される基等が挙げられる。

5 式 (e)



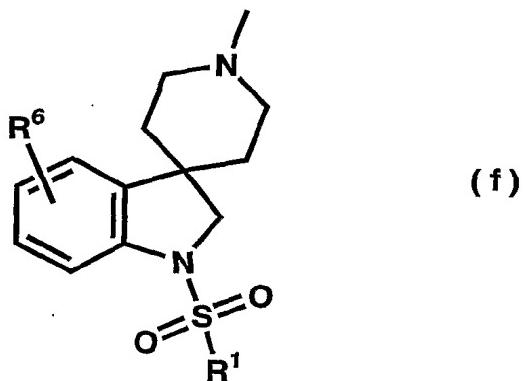
(e)

で表される基の具体例としては、例えば、次の式（e'）

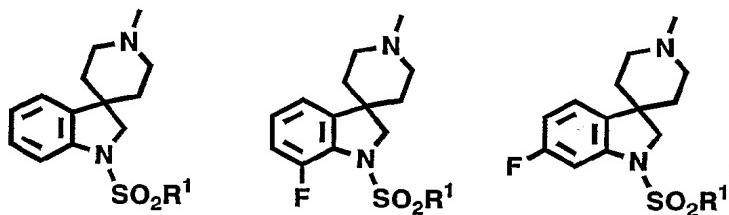


で表される基等が挙げられる。

式 (f)



5 で表される基の具体例としては、例えば、次の式 (f')

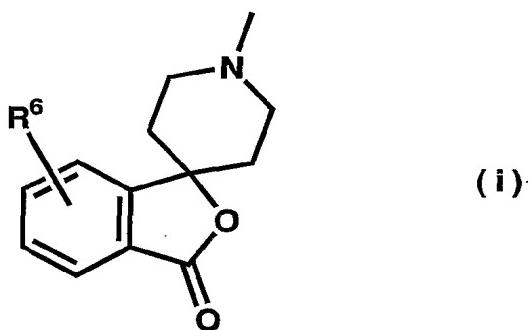


(f')

又は

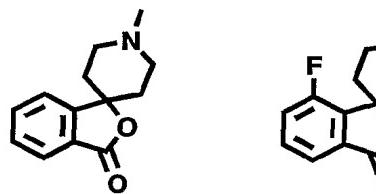
[式中、R¹は前記の意味を有する]で表される基等が挙げられる。

式(i)

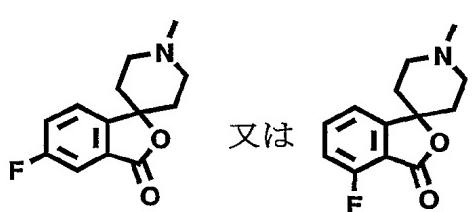


(i)

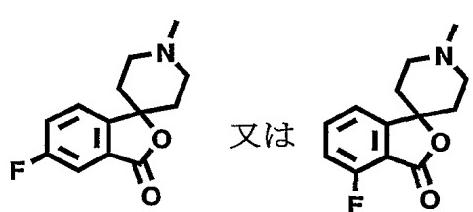
5 で表される基の具体例としては、例えば、次の式(i')



(i')



又は



で表される基等が挙げられる。

本発明の化合物は、その置換基の態様によって、光学異性体、ジアステレオ異性体、幾何異性体等の立体異性体又は互変異性体が存在する場合があるが、本発明の化合物はこれら全ての立体異性体、互変異性体及びそれらの混合物をも包含

する。

本発明化合物の種々の結晶、水和物及び溶媒和物も本発明の範囲に属する。

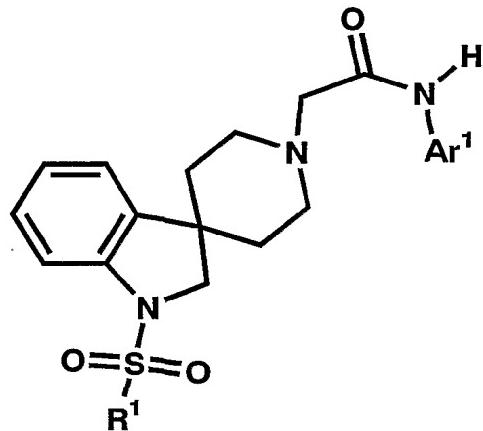
更に本発明化合物のプロドラッグもまた本発明の範囲に属する。一般的に、そのようなプロドラッグは、生体内で必要とされる化合物に容易に変換されうる本発明化合物の機能的誘導体である。したがって、本発明に係る各種疾患の処置方法においては、「投与」という言葉は、特定した化合物の投与のみならず、患者に投与した後、生体内で当該特定した化合物に変換される化合物の投与を含む。

適当なプロドラッグ誘導体の選択及び製造のための常套手段は、例えば“Design of Prodrugs” ed. H. Bundgaard, Elsevier, 1985等に記載され、ここに引用してその記載全体を本願明細書の一部となす。これらの化合物の代謝物は、本発明化合物を生物学的環境に置くことによって產生される活性化合物を含み、本発明の範囲に属する。

一般式(I)で表される化合物の具体例としては、例えば以下の表の化合物が挙げられる。

なお、表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、Phはフェニル基を意味する。

表1



No. R1 Ar 1

- | | | |
|----|----|--------------------------------|
| 1 | Me | 3-フルオロフェニル |
| 2 | Me | 4-フルオロフェニル |
| 3 | Me | 3, 4-ジフルオロフェニル |
| 4 | Me | 3-クロロフェニル |
| 5 | Me | 4-クロロフェニル |
| 6 | Me | 3, 4-ジクロロフェニル |
| 7 | Me | 4-アセチルフェニル |
| 8 | Me | 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル |
| 9 | Me | 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル |
| 10 | Me | 2-ビフェニル |
| 11 | Me | 3-ビフェニル |
| 12 | Me | 4-ビフェニル |
| 13 | Me | 4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル |
| 14 | Me | 4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル |
| 15 | Me | 4-(2-チアゾリル)フェニル |
| 16 | Me | 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル |
| 17 | Me | 3-(2-ピリジル)フェニル |
| 18 | Me | 3-(4-ピリジル)フェニル |
| 19 | Me | 4-(2-ピリジル)フェニル |
| 20 | Me | 4-(3-ピリジル)フェニル |
| 21 | Me | 4-(4-ピリジル)フェニル |
| 22 | Me | 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル |
| 23 | Me | 4-(4-ピリミジニル)フェニル |
| 24 | Me | 4-ベンゾイルフェニル |
| 25 | Me | 4-(2-ピリジカルボニル)フェニル |
| 26 | Me | 1-ナフチル |
| 27 | Me | 9-オキソ-3-フルオレニル |
| 28 | Me | 1-メチル-2-イミダゾリル |
| 29 | Me | 1-フェニル-4-イミダゾリル |

(表1の続き)

- 30 Me 1 - (2-フルオロフェニル) - 4-イミダゾリル
 31 Me 1 - (3-フルオロフェニル) - 4-イミダゾリル
 32 Me 1 - (4-フルオロフェニル) - 4-イミダゾリル
 33 Me 1 - (2, 3-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル
 34 Me 1 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル
 35 Me 1 - (3, 5-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル
 36 Me 1 - (3-クロロフェニル) - 4-イミダゾリル
 37 Me 1 - (2-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル
 38 Me 1 - (3-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル
 39 Me 1 - (4-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル
 40 Me 1 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 4-イミダゾリル
 41 Me 1 - [3 - (2-ヒドロキシエチル) フェニル] - 4-イミダゾリル
 42 Me 1 - [3 - (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] - 4-イミダゾリル
 43 Me 1 - (3-メトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
 44 Me 1 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
 45 Me 1 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
 46 Me 1 - (4-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
 47 Me 1 - (2-ピリジル) - 4-イミダゾリル
 48 Me 1 - (4-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
 49 Me 1 - (5-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
 50 Me 1 - (7-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
 51 Me 1 - (2-キノリル) - 4-イミダゾリル
 52 Me 1 - (3-キノリル) - 4-イミダゾリル
 53 Me 1 - (4-キノリル) - 4-イミダゾリル
 54 Me 1 - (5-キノリル) - 4-イミダゾリル
 55 Me 1 - (6-キノリル) - 4-イミダゾリル
 56 Me 1 - (8-キノリル) - 4-イミダゾリル
 57 Me 1 - フェニル-3-ピラゾリル
 58 Me 5 - フェニル-3-ピラゾリル
 59 Me 5 - (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
 60 Me 5 - (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
 61 Me 5 - (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
 62 Me 5 - (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
 63 Me 5 - (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
 64 Me 5 - (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
 65 Me 5 - (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
 66 Me 5 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
 67 Me 5 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
 68 Me 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
 69 Me 5 - (2-ピリジル) - 3-ピラゾリル

(表1の続き)

- 70 Me 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル
 71 Me 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル
 72 Me 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル
 73 Me 2-エチル-4-チアゾリル
 74 Me 4-フェニル-2-チアゾリル
 75 Me 5-フェニル-2-チアゾリル
 76 Me 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 77 Me 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 78 Me 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル
 79 Me 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル
 80 Me 4-フェニル-2-オキサゾリル
 81 Me 5-フェニル-2-オキサゾリル
 82 Me 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 83 Me 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 84 Me 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 85 Me 3-フェニル-5-イソオキサゾリル
 86 Me 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 87 Me 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 88 Me 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 89 Me 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル
 90 Me 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
 91 Me 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 92 Me 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 93 Me 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 94 Me 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 95 Me 5-フェニル-2-ピリジル
 96 Me 5-フェニル-3-ピリジル
 97 Me 6-フェニル-3-ピリジル
 98 Me 2-フェニル-4-ピリジル
 99 Me 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル
 100 Me 5-ベンゾイル-2-ピリジル
 101 Me 6-ベンゾイル-3-ピリジル
 102 Me 5-クロロ-2-ピラジニル
 103 Me 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル
 104 Me 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
 105 Me 5-アセチル-2-ピラジニル
 106 Me 5-プロピオニル-2-ピラジニル
 107 Me 5-フェニル-2-ピラジニル
 108 Me 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
 109 Me 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル

(表1の続き)

- 110 Me 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
 111 Me 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
 112 Me 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
 113 Me 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
 114 Me 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
 115 Me 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル
 116 Me 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル
 117 Me 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル
 118 Me 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
 119 Me 5-ベンゾイル-2-ピラジニル
 120 Me 5-(2-ピリジカルボニル)-2-ピラジニル
 121 Me 5-アセチル-2-ピリミジニル
 122 Me 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル
 123 Me 4-フェニル-2-ピリミジニル
 124 Me 5-フェニル-2-ピリミジニル
 125 Me 2-フェニル-4-ピリミジニル
 126 Me 6-フェニル-4-ピリミジニル
 127 Me 2-フェニル-5-ピリミジニル
 128 Me 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 129 Me 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 130 Me 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 131 Me 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 132 Me 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 133 Me 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 134 Me 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 135 Me 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 136 Me 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 137 Me 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 138 Me 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 139 Me 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 140 Me 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 141 Me 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 142 Me 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 143 Me 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
 144 Me 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
 145 Me 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 146 Me 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 147 Me 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 148 Me 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 149 Me 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル

(表1の続き)

- 150 Me 5-(2-フルオロー-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 151 Me 5-(3-フルオロー-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 152 Me 6-フェニル-3-ピリダジニル
 153 Me 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
 154 Me 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
 155 Me 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
 156 Me 2-ベンゾチアゾリル
 157 Me 5-フルオロー-2-ベンゾチアゾリル
 158 Me 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
 159 Me 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
 160 Me 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
 161 Me 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
 162 Me 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
 163 Me 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
 164 Me 6-メトキシ-7-アザベンゾチアゾール-2-イル
 165 Me 3-キノリル
 166 Me 6-キノリル
 167 Me 6-メチル-2-キノリル
 168 Me 7-メチル-2-キノリル
 169 Me 8-メチル-2-キノリル
 170 Me 2-メチル-6-キノリル
 171 Me 6-クロロ-2-キノキサリニル
 172 Me 7-クロロ-2-キノキサリニル
 173 Me 6-メチル-2-キノキサリニル
 174 Me 1, 5-ナフチリジン-2-イル
 175 Me 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 176 Me 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 177 Me 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 178 Me 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 179 Me 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 180 Et 3-フルオロフェニル
 181 Et 4-フルオロフェニル
 182 Et 3, 4-ジフルオロフェニル
 183 Et 3-クロロフェニル
 184 Et 4-クロロフェニル
 185 Et 3, 4-ジクロロフェニル
 186 Et 4-アセチルフェニル
 187 Et 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロー-2-ナフチル
 188 Et 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
 189 Et 2-ビフェニリル

(表1の続き)

- 190 Et 3-ビフェニリル
 191 Et 4-ビフェニリル
 192 Et 4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
 193 Et 4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
 194 Et 4-(2-チアゾリル) フェニル
 195 Et 4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
 196 Et 3-(2-ピリジル) フェニル
 197 Et 3-(4-ピリジル) フェニル
 198 Et 4-(2-ピリジル) フェニル
 199 Et 4-(3-ピリジル) フェニル
 200 Et 4-(4-ピリジル) フェニル
 201 Et 4-(2-エチル-4-ピリジル) フェニル
 202 Et 4-(4-ピリミジニル) フェニル
 203 Et 4-ベンゾイルフェニル
 204 Et 4-(2-ピリジルカルボニル) フェニル
 205 Et 1-ナフチル
 206 Et 9-オキソ-3-フルオレニル
 207 Et 1-メチル-2-イミダゾリル
 208 Et 1-フェニル-4-イミダゾリル
 209 Et 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 210 Et 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 211 Et 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 212 Et 1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 213 Et 1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 214 Et 1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 215 Et 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
 216 Et 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 217 Et 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 218 Et 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 219 Et 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
 220 Et 1-[3-(2-ヒドロキシエチル) フェニル]-4-イミダゾリル
 221 Et 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル]-4-イミダゾリル
 222 Et 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 223 Et 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 224 Et 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 225 Et 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 226 Et 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル
 227 Et 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 228 Et 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 229 Et 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル

(表1の続き)

- 230 Et 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル
 231 Et 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル
 232 Et 1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル
 233 Et 1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル
 234 Et 1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル
 235 Et 1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル
 236 Et 1-フェニル-3-ピラゾリル
 237 Et 5-フェニル-3-ピラゾリル
 238 Et 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 239 Et 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 240 Et 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 241 Et 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 242 Et 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 243 Et 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 244 Et 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 245 Et 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 246 Et 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 247 Et 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
 248 Et 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル
 249 Et 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル
 250 Et 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル
 251 Et 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル
 252 Et 2-エチル-4-チアゾリル
 253 Et 4-フェニル-2-チアゾリル
 254 Et 5-フェニル-2-チアゾリル
 255 Et 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 256 Et 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 257 Et 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル
 258 Et 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル
 259 Et 4-フェニル-2-オキサゾリル
 260 Et 5-フェニル-2-オキサゾリル
 261 Et 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 262 Et 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 263 Et 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 264 Et 3-フェニル-5-イソオキサゾリル
 265 Et 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 266 Et 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 267 Et 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 268 Et 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル
 269 Et 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル

(表1の続き)

- 270 Et 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 271 Et 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 272 Et 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 273 Et 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 274 Et 5-フェニル-2-ピリジル
 275 Et 5-フェニル-3-ピリジル
 276 Et 6-フェニル-3-ピリジル
 277 Et 2-フェニル-4-ピリジル
 278 Et 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル
 279 Et 5-ベンゾイル-2-ピリジル
 280 Et 6-ベンゾイル-3-ピリジル
 281 Et 5-クロロ-2-ピラジニル
 282 Et 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル
 283 Et 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
 284 Et 5-アセチル-2-ピラジニル
 285 Et 5-プロピオニル-2-ピラジニル
 286 Et 5-フェニル-2-ピラジニル
 287 Et 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
 288 Et 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
 289 Et 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
 290 Et 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
 291 Et 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
 292 Et 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
 293 Et 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
 294 Et 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル
 295 Et 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル
 296 Et 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル
 297 Et 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
 298 Et 5-ベンゾイル-2-ピラジニル
 299 Et 5-(2-ピリジルカルボニル)-2-ピラジニル
 300 Et 5-アセチル-2-ピリミジニル
 301 Et 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル
 302 Et 4-フェニル-2-ピリミジニル
 303 Et 5-フェニル-2-ピリミジニル
 304 Et 2-フェニル-4-ピリミジニル
 305 Et 6-フェニル-4-ピリミジニル
 306 Et 2-フェニル-5-ピリミジニル
 307 Et 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 308 Et 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 309 Et 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル

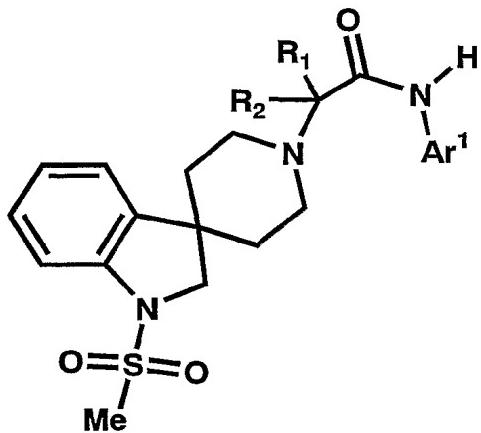
(表1の続き)

- 310 Et 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 311 Et 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 312 Et 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 313 Et 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 314 Et 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 315 Et 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 316 Et 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 317 Et 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 318 Et 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 319 Et 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 320 Et 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 321 Et 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 322 Et 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
 323 Et 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
 324 Et 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 325 Et 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 326 Et 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 327 Et 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 328 Et 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 329 Et 5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 330 Et 5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 331 Et 6-フェニル-3-ピリダジニル
 332 Et 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
 333 Et 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
 334 Et 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
 335 Et 2-ベンゾチアゾリル
 336 Et 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
 337 Et 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
 338 Et 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
 339 Et 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
 340 Et 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
 341 Et 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
 342 Et 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
 343 Et 6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル
 344 Et 3-キノリル
 345 Et 6-キノリル
 346 Et 6-メチル-2-キノリル
 347 Et 7-メチル-2-キノリル
 348 Et 8-メチル-2-キノリル
 349 Et 2-メチル-6-キノリル

(表1の続き)

- 350 Et 6-クロロ-2-キノキサリニル
- 351 Et 7-クロロ-2-キノキサリニル
- 352 Et 6-メチル-2-キノキサリニル
- 353 Et 1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 354 Et 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 355 Et 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 356 Et 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 357 Et 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 358 Et 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表 2



| No. | R1 | R2 | Ar 1 |
|-----|----|----|---------------------------------|
| 359 | Me | H | 3-フルオロフェニル |
| 360 | Me | H | 4-フルオロフェニル |
| 361 | Me | H | 3, 4-ジフルオロフェニル |
| 362 | Me | H | 3-クロロフェニル |
| 363 | Me | H | 4-クロロフェニル |
| 364 | Me | H | 3, 4-ジクロロフェニル |
| 365 | Me | H | 4-アセチルフェニル |
| 366 | Me | H | 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロー-2-ナフチル |
| 367 | Me | H | 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル |
| 368 | Me | H | 2-ビフェニル |
| 369 | Me | H | 3-ビフェニル |
| 370 | Me | H | 4-ビフェニル |
| 371 | Me | H | 4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル |
| 372 | Me | H | 4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル |
| 373 | Me | H | 4-(2-チアゾリル)フェニル |
| 374 | Me | H | 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル |
| 375 | Me | H | 3-(2-ピリジル)フェニル |
| 376 | Me | H | 3-(4-ピリジル)フェニル |
| 377 | Me | H | 4-(2-ピリジル)フェニル |
| 378 | Me | H | 4-(3-ピリジル)フェニル |
| 379 | Me | H | 4-(4-ピリジル)フェニル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|---------------------------------------|
| 380 | Me | H | 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル |
| 381 | Me | H | 4-(4-ピリミジニル)フェニル |
| 382 | Me | H | 4-ベンゾイルフェニル |
| 383 | Me | H | 4-(2-ピリジカルボニル)フェニル |
| 384 | Me | H | 1-ナフチル |
| 385 | Me | H | 9-オキソ-3-フルオレニル |
| 386 | Me | H | 1-メチル-2-イミダゾリル |
| 387 | Me | H | 1-フェニル-4-イミダゾリル |
| 388 | Me | H | 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 389 | Me | H | 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 390 | Me | H | 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 391 | Me | H | 1-(2,3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 392 | Me | H | 1-(2,4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 393 | Me | H | 1-(3,5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 394 | Me | H | 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 395 | Me | H | 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 396 | Me | H | 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 397 | Me | H | 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 398 | Me | H | 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル |
| 399 | Me | H | 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル |
| 400 | Me | H | 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル |
| 401 | Me | H | 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 402 | Me | H | 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 403 | Me | H | 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 404 | Me | H | 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 405 | Me | H | 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル |
| 406 | Me | H | 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 407 | Me | H | 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 408 | Me | H | 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 409 | Me | H | 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 410 | Me | H | 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 411 | Me | H | 1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 412 | Me | H | 1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 413 | Me | H | 1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 414 | Me | H | 1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 415 | Me | H | 1-フェニル-3-ピラゾリル |
| 416 | Me | H | 5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 417 | Me | H | 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 418 | Me | H | 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 419 | Me | H | 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|---------------------------------------|
| 420 | Me | H | 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 421 | Me | H | 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 422 | Me | H | 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 423 | Me | H | 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 424 | Me | H | 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 425 | Me | H | 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 426 | Me | H | 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 427 | Me | H | 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル |
| 428 | Me | H | 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル |
| 429 | Me | H | 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル |
| 430 | Me | H | 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル |
| 431 | Me | H | 2-エチル-4-チアゾリル |
| 432 | Me | H | 4-フェニル-2-チアゾリル |
| 433 | Me | H | 5-フェニル-2-チアゾリル |
| 434 | Me | H | 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル |
| 435 | Me | H | 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル |
| 436 | Me | H | 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル |
| 437 | Me | H | 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル |
| 438 | Me | H | 4-フェニル-2-オキサゾリル |
| 439 | Me | H | 5-フェニル-2-オキサゾリル |
| 440 | Me | H | 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 441 | Me | H | 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 442 | Me | H | 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 443 | Me | H | 3-フェニル-5-イソオキサゾリル |
| 444 | Me | H | 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 445 | Me | H | 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 446 | Me | H | 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 447 | Me | H | 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル |
| 448 | Me | H | 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル |
| 449 | Me | H | 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 450 | Me | H | 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 451 | Me | H | 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 452 | Me | H | 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 453 | Me | H | 5-フェニル-2-ピリジル |
| 454 | Me | H | 5-フェニル-3-ピリジル |
| 455 | Me | H | 6-フェニル-3-ピリジル |
| 456 | Me | H | 2-フェニル-4-ピリジル |
| 457 | Me | H | 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル |
| 458 | Me | H | 5-ベンゾイル-2-ピリジル |
| 459 | Me | H | 6-ベンゾイル-3-ピリジル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|----------------------------------|
| 460 | Me | H | 5-クロロ-2-ピラジニル |
| 461 | Me | H | 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル |
| 462 | Me | H | 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル |
| 463 | Me | H | 5-アセチル-2-ピラジニル |
| 464 | Me | H | 5-プロピオニル-2-ピラジニル |
| 465 | Me | H | 5-フェニル-2-ピラジニル |
| 466 | Me | H | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル |
| 467 | Me | H | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル |
| 468 | Me | H | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 469 | Me | H | 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 470 | Me | H | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 471 | Me | H | 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル |
| 472 | Me | H | 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル |
| 473 | Me | H | 5-(2-ビリジル)-2-ピラジニル |
| 474 | Me | H | 5-(3-ビリジル)-2-ピラジニル |
| 475 | Me | H | 5-(5-ビリミジニル)-2-ピラジニル |
| 476 | Me | H | 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル |
| 477 | Me | H | 5-ベンゾイル-2-ピラジニル |
| 478 | Me | H | 5-(2-ビリジルカルボニル)-2-ピラジニル |
| 479 | Me | H | 5-アセチル-2-ピリミジニル |
| 480 | Me | H | 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル |
| 481 | Me | H | 4-フェニル-2-ピリミジニル |
| 482 | Me | H | 5-フェニル-2-ピリミジニル |
| 483 | Me | H | 2-フェニル-4-ピリミジニル |
| 484 | Me | H | 6-フェニル-4-ピリミジニル |
| 485 | Me | H | 2-フェニル-5-ピリミジニル |
| 486 | Me | H | 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 487 | Me | H | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 488 | Me | H | 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 489 | Me | H | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 490 | Me | H | 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 491 | Me | H | 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 492 | Me | H | 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 493 | Me | H | 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 494 | Me | H | 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 495 | Me | H | 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 496 | Me | H | 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 497 | Me | H | 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 498 | Me | H | 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 499 | Me | H | 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|--------------------------------|
| 500 | Me | H | 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 501 | Me | H | 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 502 | Me | H | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 503 | Me | H | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 504 | Me | H | 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 505 | Me | H | 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 506 | Me | H | 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 507 | Me | H | 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 508 | Me | H | 5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 509 | Me | H | 5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 510 | Me | H | 6-フェニル-3-ピリダジニル |
| 511 | Me | H | 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル |
| 512 | Me | H | 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 513 | Me | H | 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 514 | Me | H | 2-ベンゾチアゾリル |
| 515 | Me | H | 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 516 | Me | H | 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 517 | Me | H | 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 518 | Me | H | 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル |
| 519 | Me | H | 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル |
| 520 | Me | H | 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 521 | Me | H | 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 522 | Me | H | 6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル |
| 523 | Me | H | 3-キノリル |
| 524 | Me | H | 6-キノリル |
| 525 | Me | H | 6-メチル-2-キノリル |
| 526 | Me | H | 7-メチル-2-キノリル |
| 527 | Me | H | 8-メチル-2-キノリル |
| 528 | Me | H | 2-メチル-6-キノリル |
| 529 | Me | H | 6-クロロ-2-キノキサリニル |
| 530 | Me | H | 7-クロロ-2-キノキサリニル |
| 531 | Me | H | 6-メチル-2-キノキサリニル |
| 532 | Me | H | 1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 533 | Me | H | 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 534 | Me | H | 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 535 | Me | H | 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 536 | Me | H | 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 537 | Me | H | 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 538 | Et | H | 3-フルオロフェニル |
| 539 | Et | H | 4-フルオロフェニル |

(表2の続き)

- 540 Et H 3, 4-ジフルオロフェニル
 541 Et H 3-クロロフェニル
 542 Et H 4-クロロフェニル
 543 Et H 3, 4-ジクロロフェニル
 544 Et H 4-アセチルフェニル
 545 Et H 5-オキゾ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロー-2-ナフチル
 546 Et H 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
 547 Et H 2-ビフェニリル
 548 Et H 3-ビフェニリル
 549 Et H 4-ビフェニリル
 550 Et H 4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル
 551 Et H 4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル
 552 Et H 4-(2-チアゾリル)フェニル
 553 Et H 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル
 554 Et H 3-(2-ピリジル)フェニル
 555 Et H 3-(4-ピリジル)フェニル
 556 Et H 4-(2-ピリジル)フェニル
 557 Et H 4-(3-ピリジル)フェニル
 558 Et H 4-(4-ピリジル)フェニル
 559 Et H 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル
 560 Et H 4-(4-ピリミジニル)フェニル
 561 Et H 4-ベンゾイルフェニル
 562 Et H 4-(2-ピリジカルボニル)フェニル
 563 Et H 1-ナフチル
 564 Et H 9-オキゾ-3-フルオレニル
 565 Et H 1-メチル-2-イミダゾリル
 566 Et H 1-フェニル-4-イミダゾリル
 567 Et H 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 568 Et H 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 569 Et H 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 570 Et H 1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 571 Et H 1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 572 Et H 1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 573 Et H 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
 574 Et H 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 575 Et H 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 576 Et H 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 577 Et H 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
 578 Et H 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 579 Et H 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|----------------------------------|
| 580 | Et | H | 1 - (3-メトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 581 | Et | H | 1 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 582 | Et | H | 1 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 583 | Et | H | 1 - (4-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 584 | Et | H | 1 - (2-ピリジル) - 4-イミダゾリル |
| 585 | Et | H | 1 - (4-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 586 | Et | H | 1 - (5-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 587 | Et | H | 1 - (7-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 588 | Et | H | 1 - (2-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 589 | Et | H | 1 - (3-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 590 | Et | H | 1 - (4-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 591 | Et | H | 1 - (5-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 592 | Et | H | 1 - (6-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 593 | Et | H | 1 - (8-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 594 | Et | H | 1-フェニル-3-ピラゾリル |
| 595 | Et | H | 5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 596 | Et | H | 5- (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 597 | Et | H | 5- (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 598 | Et | H | 5- (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 599 | Et | H | 5- (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 600 | Et | H | 5- (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 601 | Et | H | 5- (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 602 | Et | H | 5- (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 603 | Et | H | 5- (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 604 | Et | H | 5- (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 605 | Et | H | 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 606 | Et | H | 5- (2-ピリジル) - 3-ピラゾリル |
| 607 | Et | H | 5- (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ピラゾリル |
| 608 | Et | H | 5- (2-キノリル) - 3-ピラゾリル |
| 609 | Et | H | 5- (3-キノリル) - 3-ピラゾリル |
| 610 | Et | H | 2-エチル-4-チアゾリル |
| 611 | Et | H | 4-フェニル-2-チアゾリル |
| 612 | Et | H | 5-フェニル-2-チアゾリル |
| 613 | Et | H | 5- (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル |
| 614 | Et | H | 5- (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル |
| 615 | Et | H | 5- (4-メトキシフェニル) - 2-チアゾリル |
| 616 | Et | H | 5- (2-ピリジル) - 2-チアゾリル |
| 617 | Et | H | 4-フェニル-2-オキサゾリル |
| 618 | Et | H | 5-フェニル-2-オキサゾリル |
| 619 | Et | H | 4- (3-メトキシフェニル) - 2-オキサゾリル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|-------------------------------------|
| 620 | Et | H | 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 621 | Et | H | 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 622 | Et | H | 3-フェニル-5-イソオキサゾリル |
| 623 | Et | H | 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 624 | Et | H | 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 625 | Et | H | 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 626 | Et | H | 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル |
| 627 | Et | H | 5-フェニル-1,2,4-チアジアゾール-3-イル |
| 628 | Et | H | 5-フェニル-1,3,4-チアジアゾール-2-イル |
| 629 | Et | H | 5-(3-クロロフェニル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル |
| 630 | Et | H | 5-(2-ピリジル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル |
| 631 | Et | H | 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル |
| 632 | Et | H | 5-フェニル-2-ピリジル |
| 633 | Et | H | 5-フェニル-3-ピリジル |
| 634 | Et | H | 6-フェニル-3-ピリジル |
| 635 | Et | H | 2-フェニル-4-ピリジル |
| 636 | Et | H | 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 637 | Et | H | 5-ベンゾイル-2-ピリジル |
| 638 | Et | H | 6-ベンゾイル-3-ピリジル |
| 639 | Et | H | 5-クロロ-2-ピラジニル |
| 640 | Et | H | 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル |
| 641 | Et | H | 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル |
| 642 | Et | H | 5-アセチル-2-ピラジニル |
| 643 | Et | H | 5-プロピオニル-2-ピラジニル |
| 644 | Et | H | 5-フェニル-2-ピラジニル |
| 645 | Et | H | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル |
| 646 | Et | H | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル |
| 647 | Et | H | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 648 | Et | H | 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 649 | Et | H | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 650 | Et | H | 5-(1,2,4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル |
| 651 | Et | H | 5-(1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル |
| 652 | Et | H | 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 653 | Et | H | 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 654 | Et | H | 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル |
| 655 | Et | H | 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル |
| 656 | Et | H | 5-ベンゾイル-2-ピラジニル |
| 657 | Et | H | 5-(2-ピリジカルボニル)-2-ピラジニル |
| 658 | Et | H | 5-アセチル-2-ピリミジニル |
| 659 | Et | H | 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|--------------------------------|
| 660 | Et | H | 4-フェニル-2-ピリミジニル |
| 661 | Et | H | 5-フェニル-2-ピリミジニル |
| 662 | Et | H | 2-フェニル-4-ピリミジニル |
| 663 | Et | H | 6-フェニル-4-ピリミジニル |
| 664 | Et | H | 2-フェニル-5-ピリミジニル |
| 665 | Et | H | 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 666 | Et | H | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 667 | Et | H | 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 668 | Et | H | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 669 | Et | H | 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 670 | Et | H | 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 671 | Et | H | 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 672 | Et | H | 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 673 | Et | H | 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 674 | Et | H | 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 675 | Et | H | 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 676 | Et | H | 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 677 | Et | H | 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 678 | Et | H | 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 679 | Et | H | 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 680 | Et | H | 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 681 | Et | H | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 682 | Et | H | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 683 | Et | H | 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 684 | Et | H | 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 685 | Et | H | 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 686 | Et | H | 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 687 | Et | H | 5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 688 | Et | H | 5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 689 | Et | H | 6-フェニル-3-ピリダジニル |
| 690 | Et | H | 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル |
| 691 | Et | H | 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 692 | Et | H | 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 693 | Et | H | 2-ベンゾチアゾリル |
| 694 | Et | H | 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 695 | Et | H | 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 696 | Et | H | 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 697 | Et | H | 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル |
| 698 | Et | H | 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル |
| 699 | Et | H | 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|---------------------------------|
| 700 | Et | H | 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 701 | Et | H | 6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル |
| 702 | Et | H | 3-キノリル |
| 703 | Et | H | 6-キノリル |
| 704 | Et | H | 6-メチル-2-キノリル |
| 705 | Et | H | 7-メチル-2-キノリル |
| 706 | Et | H | 8-メチル-2-キノリル |
| 707 | Et | H | 2-メチル-6-キノリル |
| 708 | Et | H | 6-クロロ-2-キノキサリニル |
| 709 | Et | H | 7-クロロ-2-キノキサリニル |
| 710 | Et | H | 6-メチル-2-キノキサリニル |
| 711 | Et | H | 1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 712 | Et | H | 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 713 | Et | H | 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 714 | Et | H | 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 715 | Et | H | 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 716 | Et | H | 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 717 | Ph | H | 3-フルオロフェニル |
| 718 | Ph | H | 4-フルオロフェニル |
| 719 | Ph | H | 3, 4-ジフルオロフェニル |
| 720 | Ph | H | 3-クロロフェニル |
| 721 | Ph | H | 4-クロロフェニル |
| 722 | Ph | H | 3, 4-ジクロロフェニル |
| 723 | Ph | H | 4-アセチルフェニル |
| 724 | Ph | H | 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロー-2-ナフチル |
| 725 | Ph | H | 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル |
| 726 | Ph | H | 2-ビフェニリル |
| 727 | Ph | H | 3-ビフェニリル |
| 728 | Ph | H | 4-ビフェニリル |
| 729 | Ph | H | 4- (1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル |
| 730 | Ph | H | 4- (1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル |
| 731 | Ph | H | 4- (2-チアゾリル) フェニル |
| 732 | Ph | H | 4- (2-エチル-4-チアゾリル) フェニル |
| 733 | Ph | H | 3- (2-ピリジル) フェニル |
| 734 | Ph | H | 3- (4-ピリジル) フェニル |
| 735 | Ph | H | 4- (2-ピリジル) フェニル |
| 736 | Ph | H | 4- (3-ピリジル) フェニル |
| 737 | Ph | H | 4- (4-ピリジル) フェニル |
| 738 | Ph | H | 4- (2-エチル-4-ピリジル) フェニル |
| 739 | Ph | H | 4- (4-ピリミジニル) フェニル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|---------------------------------------|
| 740 | Ph | H | 4-ベンゾイルフェニル |
| 741 | Ph | H | 4-(2-ピリジルカルボニル)フェニル |
| 742 | Ph | H | 1-ナフチル |
| 743 | Ph | H | 9-オキソ-3-フルオレニル |
| 744 | Ph | H | 1-メチル-2-イミダゾリル |
| 745 | Ph | H | 1-フェニル-4-イミダゾリル |
| 746 | Ph | H | 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 747 | Ph | H | 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 748 | Ph | H | 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 749 | Ph | H | 1-(2,3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 750 | Ph | H | 1-(2,4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 751 | Ph | H | 1-(3,5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 752 | Ph | H | 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 753 | Ph | H | 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 754 | Ph | H | 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 755 | Ph | H | 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 756 | Ph | H | 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル |
| 757 | Ph | H | 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル |
| 758 | Ph | H | 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル |
| 759 | Ph | H | 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 760 | Ph | H | 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 761 | Ph | H | 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 762 | Ph | H | 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 763 | Ph | H | 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル |
| 764 | Ph | H | 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 765 | Ph | H | 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 766 | Ph | H | 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 767 | Ph | H | 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 768 | Ph | H | 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 769 | Ph | H | 1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 770 | Ph | H | 1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 771 | Ph | H | 1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 772 | Ph | H | 1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 773 | Ph | H | 1-フェニル-3-ピラゾリル |
| 774 | Ph | H | 5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 775 | Ph | H | 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 776 | Ph | H | 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 777 | Ph | H | 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 778 | Ph | H | 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 779 | Ph | H | 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|---------------------------------------|
| 780 | Ph | H | 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 781 | Ph | H | 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 782 | Ph | H | 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 783 | Ph | H | 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 784 | Ph | H | 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 785 | Ph | H | 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル |
| 786 | Ph | H | 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル |
| 787 | Ph | H | 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル |
| 788 | Ph | H | 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル |
| 789 | Ph | H | 2-エチル-4-チアゾリル |
| 790 | Ph | H | 4-フェニル-2-チアゾリル |
| 791 | Ph | H | 5-フェニル-2-チアゾリル |
| 792 | Ph | H | 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル |
| 793 | Ph | H | 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル |
| 794 | Ph | H | 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル |
| 795 | Ph | H | 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル |
| 796 | Ph | H | 4-フェニル-2-オキサゾリル |
| 797 | Ph | H | 5-フェニル-2-オキサゾリル |
| 798 | Ph | H | 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 799 | Ph | H | 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 800 | Ph | H | 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 801 | Ph | H | 3-フェニル-5-イソオキサゾリル |
| 802 | Ph | H | 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 803 | Ph | H | 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 804 | Ph | H | 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 805 | Ph | H | 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル |
| 806 | Ph | H | 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル |
| 807 | Ph | H | 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 808 | Ph | H | 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 809 | Ph | H | 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 810 | Ph | H | 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 811 | Ph | H | 5-フェニル-2-ピリジル |
| 812 | Ph | H | 5-フェニル-3-ピリジル |
| 813 | Ph | H | 6-フェニル-3-ピリジル |
| 814 | Ph | H | 2-フェニル-4-ピリジル |
| 815 | Ph | H | 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル |
| 816 | Ph | H | 5-ベンゾイル-2-ピリジル |
| 817 | Ph | H | 6-ベンゾイル-3-ピリジル |
| 818 | Ph | H | 5-クロロ-2-ピラジニル |
| 819 | Ph | H | 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|---|----------------------------------|
| 820 | Ph | H | 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル |
| 821 | Ph | H | 5-アセチル-2-ピラジニル |
| 822 | Ph | H | 5-プロピオニル-2-ピラジニル |
| 823 | Ph | H | 5-フェニル-2-ピラジニル |
| 824 | Ph | H | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル |
| 825 | Ph | H | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル |
| 826 | Ph | H | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 827 | Ph | H | 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 828 | Ph | H | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 829 | Ph | H | 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル |
| 830 | Ph | H | 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル |
| 831 | Ph | H | 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 832 | Ph | H | 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 833 | Ph | H | 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル |
| 834 | Ph | H | 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル |
| 835 | Ph | H | 5-ベンゾイル-2-ピラジニル |
| 836 | Ph | H | 5-(2-ピリジカルボニル)-2-ピラジニル |
| 837 | Ph | H | 5-アセチル-2-ピリミジニル |
| 838 | Ph | H | 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル |
| 839 | Ph | H | 4-フェニル-2-ピリミジニル |
| 840 | Ph | H | 5-フェニル-2-ピリミジニル |
| 841 | Ph | H | 2-フェニル-4-ピリミジニル |
| 842 | Ph | H | 6-フェニル-4-ピリミジニル |
| 843 | Ph | H | 2-フェニル-5-ピリミジニル |
| 844 | Ph | H | 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 845 | Ph | H | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 846 | Ph | H | 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 847 | Ph | H | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 848 | Ph | H | 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 849 | Ph | H | 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 850 | Ph | H | 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 851 | Ph | H | 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 852 | Ph | H | 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 853 | Ph | H | 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 854 | Ph | H | 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 855 | Ph | H | 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 856 | Ph | H | 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 857 | Ph | H | 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 858 | Ph | H | 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 859 | Ph | H | 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|----|--------------------------------|
| 860 | Ph | H | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 861 | Ph | H | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 862 | Ph | H | 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 863 | Ph | H | 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 864 | Ph | H | 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 865 | Ph | H | 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 866 | Ph | H | 5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 867 | Ph | H | 5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 868 | Ph | H | 6-フェニル-3-ピリダジニル |
| 869 | Ph | H | 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル |
| 870 | Ph | H | 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 871 | Ph | H | 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 872 | Ph | H | 2-ベンゾチアゾリル |
| 873 | Ph | H | 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 874 | Ph | H | 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 875 | Ph | H | 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 876 | Ph | H | 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル |
| 877 | Ph | H | 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル |
| 878 | Ph | H | 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 879 | Ph | H | 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 880 | Ph | H | 6-メトキシビリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル |
| 881 | Ph | H | 3-キノリル |
| 882 | Ph | H | 6-キノリル |
| 883 | Ph | H | 6-メチル-2-キノリル |
| 884 | Ph | H | 7-メチル-2-キノリル |
| 885 | Ph | H | 8-メチル-2-キノリル |
| 886 | Ph | H | 2-メチル-6-キノリル |
| 887 | Ph | H | 6-クロロ-2-キノキサリニル |
| 888 | Ph | H | 7-クロロ-2-キノキサリニル |
| 889 | Ph | H | 6-メチル-2-キノキサリニル |
| 890 | Ph | H | 1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 891 | Ph | H | 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 892 | Ph | H | 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 893 | Ph | H | 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 894 | Ph | H | 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 895 | Ph | H | 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 896 | Me | Me | 3-フルオロフェニル |
| 897 | Me | Me | 4-フルオロフェニル |
| 898 | Me | Me | 3, 4-ジフルオロフェニル |
| 899 | Me | Me | 3-クロロフェニル |

(表2の続き)

- 900 Me Me 4-クロロフェニル
 901 Me Me 3, 4-ジクロロフェニル
 902 Me Me 4-アセチルフェニル
 903 Me Me 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロー-2-ナフチル
 904 Me Me 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
 905 Me Me 2-ビフェニリル
 906 Me Me 3-ビフェニリル
 907 Me Me 4-ビフェニリル
 908 Me Me 4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
 909 Me Me 4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
 910 Me Me 4-(2-チアゾリル) フェニル
 911 Me Me 4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
 912 Me Me 3-(2-ピリジル) フェニル
 913 Me Me 3-(4-ピリジル) フェニル
 914 Me Me 4-(2-ピリジル) フェニル
 915 Me Me 4-(3-ピリジル) フェニル
 916 Me Me 4-(4-ピリジル) フェニル
 917 Me Me 4-(2-エチル-4-ピリジル) フェニル
 918 Me Me 4-(4-ピリミジニル) フェニル
 919 Me Me 4-ベンゾイルフェニル
 920 Me Me 4-(2-ピリジルカルボニル) フェニル
 921 Me Me 1-ナフチル
 922 Me Me 9-オキソ-3-フルオレニル
 923 Me Me 1-メチル-2-イミダゾリル
 924 Me Me 1-フェニル-4-イミダゾリル
 925 Me Me 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 926 Me Me 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 927 Me Me 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 928 Me Me 1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 929 Me Me 1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 930 Me Me 1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 931 Me Me 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
 932 Me Me 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 933 Me Me 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 934 Me Me 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 935 Me Me 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
 936 Me Me 1-[3-(2-ヒドロキシエチル) フェニル]-4-イミダゾリル
 937 Me Me 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル]-4-イミダゾリル
 938 Me Me 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 939 Me Me 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル

(表2の続き)

| | | | |
|-----|----|----|----------------------------------|
| 940 | Me | Me | 1 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 941 | Me | Me | 1 - (4-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 942 | Me | Me | 1 - (2-ピリジル) - 4-イミダゾリル |
| 943 | Me | Me | 1 - (4-ベンゾ[b]フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 944 | Me | Me | 1 - (5-ベンゾ[b]フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 945 | Me | Me | 1 - (7-ベンゾ[b]フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 946 | Me | Me | 1 - (2-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 947 | Me | Me | 1 - (3-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 948 | Me | Me | 1 - (4-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 949 | Me | Me | 1 - (5-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 950 | Me | Me | 1 - (6-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 951 | Me | Me | 1 - (8-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 952 | Me | Me | 1-フェニル-3-ピラゾリル |
| 953 | Me | Me | 5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 954 | Me | Me | 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 955 | Me | Me | 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 956 | Me | Me | 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 957 | Me | Me | 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 958 | Me | Me | 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 959 | Me | Me | 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 960 | Me | Me | 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 961 | Me | Me | 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 962 | Me | Me | 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 963 | Me | Me | 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 964 | Me | Me | 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル |
| 965 | Me | Me | 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル |
| 966 | Me | Me | 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル |
| 967 | Me | Me | 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル |
| 968 | Me | Me | 2-エチル-4-チアゾリル |
| 969 | Me | Me | 4-フェニル-2-チアゾリル |
| 970 | Me | Me | 5-フェニル-2-チアゾリル |
| 971 | Me | Me | 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル |
| 972 | Me | Me | 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル |
| 973 | Me | Me | 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル |
| 974 | Me | Me | 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル |
| 975 | Me | Me | 4-フェニル-2-オキサゾリル |
| 976 | Me | Me | 5-フェニル-2-オキサゾリル |
| 977 | Me | Me | 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 978 | Me | Me | 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 979 | Me | Me | 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |

(表2の続き)

| | | | |
|------|----|----|---------------------------------------|
| 980 | Me | Me | 3-フェニル-5-イソオキサゾリル |
| 981 | Me | Me | 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 982 | Me | Me | 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 983 | Me | Me | 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 984 | Me | Me | 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル |
| 985 | Me | Me | 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル |
| 986 | Me | Me | 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 987 | Me | Me | 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 988 | Me | Me | 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 989 | Me | Me | 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 990 | Me | Me | 5-フェニル-2-ピリジル |
| 991 | Me | Me | 5-フェニル-3-ピリジル |
| 992 | Me | Me | 6-フェニル-3-ピリジル |
| 993 | Me | Me | 2-フェニル-4-ピリジル |
| 994 | Me | Me | 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル |
| 995 | Me | Me | 5-ベンゾイル-2-ピリジル |
| 996 | Me | Me | 6-ベンゾイル-3-ピリジル |
| 997 | Me | Me | 5-クロロ-2-ピラジニル |
| 998 | Me | Me | 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル |
| 999 | Me | Me | 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル |
| 1000 | Me | Me | 5-アセチル-2-ピラジニル |
| 1001 | Me | Me | 5-プロピオニル-2-ピラジニル |
| 1002 | Me | Me | 5-フェニル-2-ピラジニル |
| 1003 | Me | Me | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル |
| 1004 | Me | Me | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル |
| 1005 | Me | Me | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 1006 | Me | Me | 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 1007 | Me | Me | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 1008 | Me | Me | 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル |
| 1009 | Me | Mc | 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル |
| 1010 | Me | Me | 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 1011 | Me | Me | 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 1012 | Me | Me | 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル |
| 1013 | Me | Me | 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル |
| 1014 | Me | Me | 5-ベンゾイル-2-ピラジニル |
| 1015 | Me | Me | 5-(2-ピリジカルボニル)-2-ピラジニル |
| 1016 | Me | Me | 5-アセチル-2-ピリミジニル |
| 1017 | Me | Me | 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル |
| 1018 | Me | Me | 4-フェニル-2-ピリミジニル |
| 1019 | Me | Me | 5-フェニル-2-ピリミジニル |

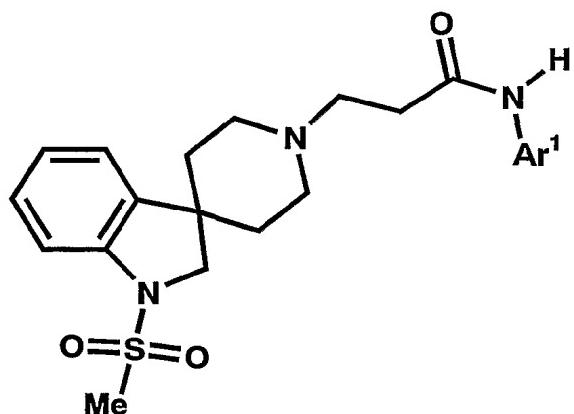
(表2の続き)

| | | |
|---------|----|--------------------------------|
| 1020 Me | Me | 2-フェニル-4-ピリミジニル |
| 1021 Me | Me | 6-フェニル-4-ピリミジニル |
| 1022 Me | Me | 2-フェニル-5-ピリミジニル |
| 1023 Me | Me | 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1024 Me | Me | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1025 Me | Me | 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1026 Me | Me | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1027 Me | Me | 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1028 Me | Me | 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1029 Me | Me | 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1030 Me | Me | 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1031 Me | Me | 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1032 Me | Me | 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1033 Me | Me | 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1034 Me | Me | 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1035 Me | Me | 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1036 Me | Me | 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1037 Me | Me | 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1038 Me | Me | 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1039 Me | Me | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1040 Me | Me | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1041 Me | Me | 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1042 Me | Me | 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1043 Me | Me | 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1044 Me | Me | 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1045 Me | Me | 5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1046 Me | Me | 5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 1047 Me | Me | 6-フェニル-3-ピリダジニル |
| 1048 Me | Me | 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル |
| 1049 Me | Me | 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 1050 Me | Me | 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 1051 Me | Me | 2-ベンゾチアゾリル |
| 1052 Me | Me | 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 1053 Me | Me | 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 1054 Me | Me | 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 1055 Me | Me | 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル |
| 1056 Me | Me | 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル |
| 1057 Me | Me | 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 1058 Me | Me | 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 1059 Me | Me | 6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル |

(表2の続き)

| | | | |
|------|----|----|------------------------------|
| 1060 | Me | Me | 3-キノリル |
| 1061 | Me | Me | 6-キノリル |
| 1062 | Me | Me | 6-メチル-2-キノリル |
| 1063 | Me | Me | 7-メチル-2-キノリル |
| 1064 | Me | Me | 8-メチル-2-キノリル |
| 1065 | Me | Me | 2-メチル-6-キノリル |
| 1066 | Me | Me | 6-クロロ-2-キノキサリニル |
| 1067 | Me | Me | 7-クロロ-2-キノキサリニル |
| 1068 | Me | Me | 6-メチル-2-キノキサリニル |
| 1069 | Me | Me | 1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 1070 | Me | Me | 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 1071 | Me | Me | 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 1072 | Me | Me | 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 1073 | Me | Me | 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 1074 | Me | Me | 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |

表 3



No. Ar 1

- 1075 3-フルオロフェニル
1076 4-フルオロフェニル
1077 3, 4-ジフルオロフェニル
1078 3-クロロフェニル
1079 4-クロロフェニル
1080 3, 4-ジクロロフェニル
1081 4-アセチルフェニル
1082 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
1083 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
1084 2-ビフェニリル
1085 3-ビフェニリル
1086 4-ビフェニリル
1087 4- (1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
1088 4- (1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
1089 4- (2-チアゾリル) フェニル

(表3の続き)

- 1090 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル
 1091 3-(2-ピリジル)フェニル
 1092 3-(4-ピリジル)フェニル
 1093 4-(2-ピリジル)フェニル
 1094 4-(3-ピリジル)フェニル
 1095 4-(4-ピリジル)フェニル
 1096 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル
 1097 4-(4-ピリミジニル)フェニル
 1098 4-ベンゾイルフェニル
 1099 4-(2-ピリジルカルボニル)フェニル
 1100 1-ナフチル
 1101 9-オキソ-3-フルオレニル
 1102 1-メチル-2-イミダゾリル
 1103 1-フェニル-4-イミダゾリル
 1104 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1105 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1106 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1107 1-(2,3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1108 1-(2,4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1109 1-(3,5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1110 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
 1111 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1112 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1113 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1114 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
 1115 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 1116 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 1117 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1118 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1119 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1120 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1121 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル
 1122 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1123 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1124 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1125 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル
 1126 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル
 1127 1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル
 1128 1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル
 1129 1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル

(表3の続き)

- 1130 1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル
 1131 1-フェニル-3-ピラゾリル
 1132 5-フェニル-3-ピラゾリル
 1133 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1134 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1135 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1136 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1137 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1138 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1139 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1140 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1141 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1142 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
 1143 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル
 1144 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル
 1145 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル
 1146 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル
 1147 2-エチル-4-チアゾリル
 1148 4-フェニル-2-チアゾリル
 1149 5-フェニル-2-チアゾリル
 1150 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 1151 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 1152 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル
 1153 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル
 1154 4-フェニル-2-オキサゾリル
 1155 5-フェニル-2-オキサゾリル
 1156 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1157 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1158 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1159 3-フェニル-5-イソオキサゾリル
 1160 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1161 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1162 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1163 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル
 1164 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
 1165 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1166 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1167 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1168 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1169 5-フェニル-2-ピリジル

(表3の続き)

- 1170 5-フェニル-3-ピリジル
1171 6-フェニル-3-ピリジル
1172 2-フェニル-4-ピリジル
1173 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル
1174 5-ベンゾイル-2-ピリジル
1175 6-ベンゾイル-3-ピリジル
1176 5-クロロ-2-ピラジニル
1177 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル
1178 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
1179 5-アセチル-2-ピラジニル
1180 5-プロピオニル-2-ピラジニル
1181 5-フェニル-2-ピラジニル
1182 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
1183 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
1184 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
1185 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
1186 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
1187 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
1188 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
1189 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル
1190 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル
1191 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル
1192 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
1193 5-ベンゾイル-2-ピラジニル
1194 5-(2-ピリジカルボニル)-2-ピラジニル
1195 5-アセチル-2-ピリミジニル
1196 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル
1197 4-フェニル-2-ピリミジニル
1198 5-フェニル-2-ピリミジニル
1199 2-フェニル-4-ピリミジニル
1200 6-フェニル-4-ピリミジニル
1201 2-フェニル-5-ピリミジニル
1202 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
1203 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
1204 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
1205 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
1206 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
1207 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
1208 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
1209 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル

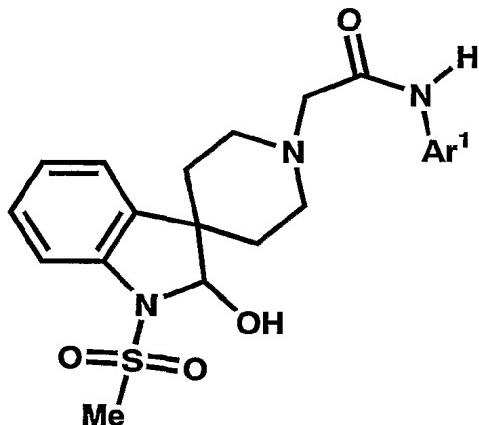
(表3の続き)

- 1210 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1211 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1212 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1213 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1214 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1215 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1216 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1217 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1218 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1219 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1220 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1221 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1222 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1223 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1224 5-(2-フルオロー-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1225 5-(3-フルオロー-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1226 6-フェニル-3-ピリダジニル
 1227 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
 1228 5-クロロー-2-ベンゾオキサゾリル
 1229 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
 1230 2-ベンゾチアゾリル
 1231 5-フルオロー-2-ベンゾチアゾリル
 1232 4-クロロー-2-ベンゾチアゾリル
 1233 6-クロロー-2-ベンゾチアゾリル
 1234 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
 1235 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
 1236 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
 1237 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
 1238 6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル
 1239 3-キノリル
 1240 6-キノリル
 1241 6-メチル-2-キノリル
 1242 7-メチル-2-キノリル
 1243 8-メチル-2-キノリル
 1244 2-メチル-6-キノリル
 1245 6-クロロー-2-キノキサリニル
 1246 7-クロロー-2-キノキサリニル
 1247 6-メチル-2-キノキサリニル
 1248 1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1249 7-クロロー-1, 5-ナフチリジン-2-イル

(表3の続き)

- 1250 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1251 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1252 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1253 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表4



No. Ar 1

- 1254 3-フルオロフェニル
 1255 4-フルオロフェニル
 1256 3, 4-ジフルオロフェニル
 1257 3-クロロフェニル
 1258 4-クロロフェニル
 1259 3, 4-ジクロロフェニル
 1260 4-アセチルフェニル
 1261 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
 1262 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
 1263 2-ビフェニリル
 1264 3-ビフェニリル
 1265 4-ビフェニリル
 1266 4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル
 1267 4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル
 1268 4-(2-チアゾリル)フェニル
 1269 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル

(表4の続き)

- 1270 3-(2-ピリジル)フェニル
 1271 3-(4-ピリジル)フェニル
 1272 4-(2-ピリジル)フェニル
 1273 4-(3-ピリジル)フェニル
 1274 4-(4-ピリジル)フェニル
 1275 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル
 1276 4-(4-ピリミジニル)フェニル
 1277 4-ベンゾイルフェニル
 1278 4-(2-ピリジルカルボニル)フェニル
 1279 1-ナフチル
 1280 9-オキソ-3-フルオレニル
 1281 1-メチル-2-イミダゾリル
 1282 1-フェニル-4-イミダゾリル
 1283 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1284 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1285 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1286 1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1287 1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1288 1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1289 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
 1290 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1291 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1292 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1293 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
 1294 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 1295 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 1296 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1297 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1298 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1299 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1300 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル
 1301 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1302 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1303 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1304 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル
 1305 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル
 1306 1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル
 1307 1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル
 1308 1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル
 1309 1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル

(表4の続き)

- 1310 1-フェニル-3-ピラゾリル
 1311 5-フェニル-3-ピラゾリル
 1312 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1313 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1314 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1315 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1316 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1317 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1318 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1319 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1320 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1321 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
 1322 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル
 1323 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル
 1324 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル
 1325 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル
 1326 2-エチル-4-チアゾリル
 1327 4-フェニル-2-チアゾリル
 1328 5-フェニル-2-チアゾリル
 1329 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 1330 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 1331 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル
 1332 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル
 1333 4-フェニル-2-オキサゾリル
 1334 5-フェニル-2-オキサゾリル
 1335 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1336 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1337 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1338 3-フェニル-5-イソオキサゾリル
 1339 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1340 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1341 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1342 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル
 1343 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
 1344 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1345 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1346 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1347 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1348 5-フェニル-2-ピリジル
 1349 5-フェニル-3-ピリジル

(表4の続き)

- 1350 6-フェニル-3-ピリジル
 1351 2-フェニル-4-ピリジル
 1352 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル
 1353 5-ベンゾイル-2-ピリジル
 1354 6-ベンゾイル-3-ピリジル
 1355 5-クロロ-2-ピラジニル
 1356 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル
 1357 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
 1358 5-アセチル-2-ピラジニル
 1359 5-プロピオニル-2-ピラジニル
 1360 5-フェニル-2-ピラジニル
 1361 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
 1362 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
 1363 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
 1364 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
 1365 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
 1366 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
 1367 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
 1368 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル
 1369 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル
 1370 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル
 1371 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
 1372 5-ベンゾイル-2-ピラジニル
 1373 5-(2-ピリジカルボニル)-2-ピラジニル
 1374 5-アセチル-2-ピリミジニル
 1375 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル
 1376 4-フェニル-2-ピリミジニル
 1377 5-フェニル-2-ピリミジニル
 1378 2-フェニル-4-ピリミジニル
 1379 6-フェニル-4-ピリミジニル
 1380 2-フェニル-5-ピリミジニル
 1381 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 1382 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 1383 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 1384 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 1385 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 1386 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 1387 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1388 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1389 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル

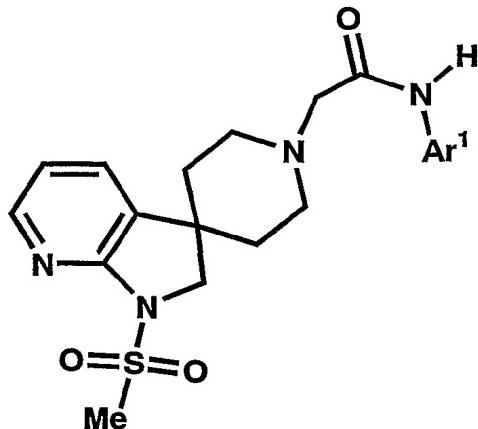
(表4の続き)

- 1390 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1391 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1392 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1393 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1394 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1395 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1396 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
1397 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
1398 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1399 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1400 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1401 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1402 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1403 5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
1404 5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1405 6-フェニル-3-ピリダジニル
1406 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
1407 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
1408 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
1409 2-ベンゾチアゾリル
1410 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
1411 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
1412 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
1413 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
1414 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
1415 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
1416 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
1417 6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル
1418 3-キノリル
1419 6-キノリル

(表4の続き)

- 1420 6-メチル-2-キノリル
- 1421 7-メチル-2-キノリル
- 1422 8-メチル-2-キノリル
- 1423 2-メチル-6-キノリル
- 1424 6-クロロ-2-キノキサリニル
- 1425 7-クロロ-2-キノキサリニル
- 1426 6-メチル-2-キノキサリニル
- 1427 1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 1428 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 1429 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 1430 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 1431 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 1432 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表 5



No. Ar 1

- 1433 3-フルオロフェニル
- 1434 4-フルオロフェニル
- 1435 3, 4-ジフルオロフェニル
- 1436 3-クロロフェニル
- 1437 4-クロロフェニル
- 1438 3, 4-ジクロロフェニル
- 1439 4-アセチルフェニル
- 1440 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
- 1441 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
- 1442 2-ビフェニル
- 1443 3-ビフェニル
- 1444 4-ビフェニル
- 1445 4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル
- 1446 4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル
- 1447 4-(2-チアゾリル)フェニル
- 1448 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル
- 1449 3-(2-ピリジル)フェニル
- 1450 3-(4-ピリジル)フェニル
- 1451 4-(2-ピリジル)フェニル
- 1452 4-(3-ピリジル)フェニル
- 1453 4-(4-ピリジル)フェニル
- 1454 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル
- 1455 4-(4-ピリミジニル)フェニル
- 1456 4-ベンゾイルフェニル
- 1457 4-(2-ピリジカルボニル)フェニル
- 1458 1-ナフチル
- 1459 9-オキソ-3-フルオレニル

(表5の続き)

- 1460 1-メチル-2-イミダゾリル
 1461 1-フェニル-4-イミダゾリル
 1462 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1463 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1464 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1465 1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1466 1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1467 1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1468 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
 1469 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1470 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1471 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1472 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
 1473 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 1474 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 1475 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1476 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1477 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1478 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1479 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル
 1480 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1481 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1482 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1483 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル
 1484 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル
 1485 1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル
 1486 1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル
 1487 1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル
 1488 1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル
 1489 1-フェニル-3-ピラゾリル
 1490 5-フェニル-3-ピラゾリル
 1491 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1492 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1493 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1494 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1495 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1496 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1497 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1498 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1499 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル

(表5の続き)

- 1500 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
 1501 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル
 1502 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル
 1503 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル
 1504 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル
 1505 2-エチル-4-チアゾリル
 1506 4-フェニル-2-チアゾリル
 1507 5-フェニル-2-チアゾリル
 1508 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 1509 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 1510 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル
 1511 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル
 1512 4-フェニル-2-オキサゾリル
 1513 5-フェニル-2-オキサゾリル
 1514 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1515 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1516 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1517 3-フェニル-5-イソオキサゾリル
 1518 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1519 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1520 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1521 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル
 1522 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
 1523 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1524 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1525 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1526 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1527 5-フェニル-2-ピリジル
 1528 5-フェニル-3-ピリジル
 1529 6-フェニル-3-ピリジル
 1530 2-フェニル-4-ピリジル
 1531 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル
 1532 5-ベンゾイル-2-ピリジル
 1533 6-ベンゾイル-3-ピリジル
 1534 5-クロロ-2-ピラジニル
 1535 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル
 1536 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
 1537 5-アセチル-2-ピラジニル
 1538 5-プロピオニル-2-ピラジニル
 1539 5-フェニル-2-ピラジニル

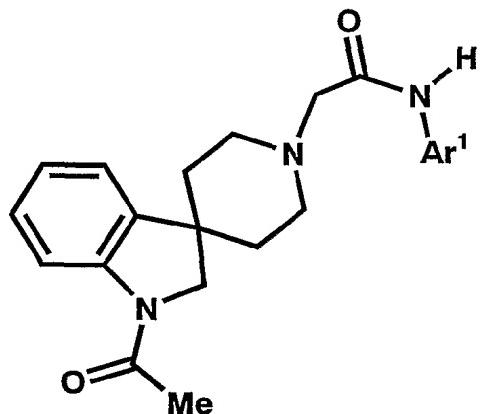
(表 5 の続き)

- 1540 5 - (3-フルオロフェニル) - 2-ピラジニル
 1541 5 - (2-クロロフェニル) - 2-ピラジニル
 1542 5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル
 1543 5 - (4-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル
 1544 5 - (2-メトキシフェニル) - 2-ピラジニル
 1545 5 - (1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル) - 2-ピラジニル
 1546 5 - (1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル) - 2-ピラジニル
 1547 5 - (2-ピリジル) - 2-ピラジニル
 1548 5 - (3-ピリジル) - 2-ピラジニル
 1549 5 - (5-ピリミジニル) - 2-ピラジニル
 1550 5 - (3-キノリル) - 2-ピラジニル
 1551 5 - ベンゾイル-2-ピラジニル
 1552 5 - (2-ピリジルカルボニル) - 2-ピラジニル
 1553 5 - アセチル-2-ピリミジニル
 1554 5 - アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル
 1555 4-フェニル-2-ピリミジニル
 1556 5-フェニル-2-ピリミジニル
 1557 2-フェニル-4-ピリミジニル
 1558 6-フェニル-4-ピリミジニル
 1559 2-フェニル-5-ピリミジニル
 1560 5 - (2-フルオロフェニル) - 2-ピリミジニル
 1561 5 - (3-フルオロフェニル) - 2-ピリミジニル
 1562 5 - (4-フルオロフェニル) - 2-ピリミジニル
 1563 5 - (2-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル
 1564 5 - (3-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル
 1565 5 - (4-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル
 1566 5 - (2-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル
 1567 5 - (3-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル
 1568 5 - (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
 1569 5 - (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
 1570 5 - (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
 1571 5 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
 1572 5 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
 1573 5 - (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
 1574 5 - (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
 1575 5 - (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル
 1576 5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル
 1577 5 - (2-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
 1578 5 - (3-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
 1579 5 - (4-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル

(表5の続き)

- 1580 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1581 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1582 5-(2-フルオロー-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
1583 5-(3-フルオロー-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1584 6-フェニル-3-ピリダジニル
1585 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
1586 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
1587 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
1588 2-ベンゾチアゾリル
1589 5-フルオロー-2-ベンゾチアゾリル
1590 4-クロロー-2-ベンゾチアゾリル
1591 6-クロロー-2-ベンゾチアゾリル
1592 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
1593 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
1594 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
1595 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
1596 6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル
1597 3-キノリル
1598 6-キノリル
1599 6-メチル-2-キノリル
1600 7-メチル-2-キノリル
1601 8-メチル-2-キノリル
1602 2-メチル-6-キノリル
1603 6-クロロ-2-キノキサリニル
1604 7-クロロ-2-キノキサリニル
1605 6-メチル-2-キノキサリニル
1606 1, 5-ナフチリジン-2-イル
1607 7-クロロー-1, 5-ナフチリジン-2-イル
1608 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
1609 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
1610 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
1611 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表6



No. Ar 1

- 1612 3-フルオロフェニル
- 1613 4-フルオロフェニル
- 1614 3, 4-ジフルオロフェニル
- 1615 3-クロロフェニル
- 1616 4-クロロフェニル
- 1617 3, 4-ジクロロフェニル
- 1618 4-アセチルフェニル
- 1619 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
- 1620 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
- 1621 2-ビフェニル
- 1622 3-ビフェニル
- 1623 4-ビフェニル
- 1624 4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル
- 1625 4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル
- 1626 4-(2-チアゾリル)フェニル
- 1627 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル
- 1628 3-(2-ピリジル)フェニル
- 1629 3-(4-ピリジル)フェニル

(表6の続き)

- 1630 4-(2-ピリジル)フェニル
 1631 4-(3-ピリジル)フェニル
 1632 4-(4-ピリジル)フェニル
 1633 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル
 1634 4-(4-ピリミジニル)フェニル
 1635 4-ベンゾイルフェニル
 1636 4-(2-ピリジルカルボニル)フェニル
 1637 1-ナフチル
 1638 9-オキソ-3-フルオレニル
 1639 1-メチル-2-イミダゾリル
 1640 1-フェニル-4-イミダゾリル
 1641 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1642 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1643 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1644 1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1645 1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1646 1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1647 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
 1648 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1649 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1650 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1651 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
 1652 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 1653 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 1654 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1655 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1656 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1657 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1658 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル
 1659 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1660 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1661 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1662 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル
 1663 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル
 1664 1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル
 1665 1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル
 1666 1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル
 1667 1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル
 1668 1-フェニル-3-ピラゾリル
 1669 5-フェニル-3-ピラゾリル

(表6の続き)

- 1670 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1671 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1672 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1673 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1674 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1675 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1676 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1677 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1678 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1679 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
 1680 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル
 1681 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル
 1682 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル
 1683 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル
 1684 2-エチル-4-チアゾリル
 1685 4-フェニル-2-チアゾリル
 1686 5-フェニル-2-チアゾリル
 1687 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 1688 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 1689 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル
 1690 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル
 1691 4-フェニル-2-オキサゾリル
 1692 5-フェニル-2-オキサゾリル
 1693 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1694 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1695 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1696 3-フェニル-5-イソオキサゾリル
 1697 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1698 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1699 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1700 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル
 1701 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
 1702 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1703 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1704 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1705 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1706 5-フェニル-2-ピリジル
 1707 5-フェニル-3-ピリジル
 1708 6-フェニル-3-ピリジル
 1709 2-フェニル-4-ピリジル

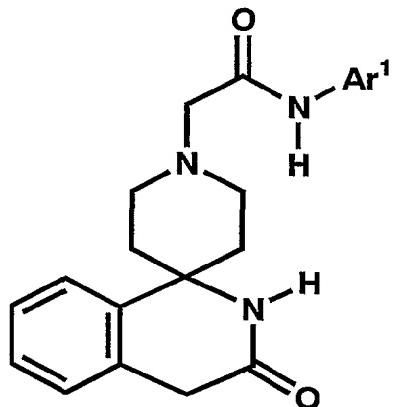
(表6の続き)

- 1710 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル
 1711 5-ベンゾイル-2-ピリジル
 1712 6-ベンゾイル-3-ピリジル
 1713 5-クロロ-2-ピラジニル
 1714 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル
 1715 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
 1716 5-アセチル-2-ピラジニル
 1717 5-プロピオニル-2-ピラジニル
 1718 5-フェニル-2-ピラジニル
 1719 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
 1720 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
 1721 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
 1722 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
 1723 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
 1724 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
 1725 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
 1726 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル
 1727 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル
 1728 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル
 1729 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
 1730 5-ベンゾイル-2-ピラジニル
 1731 5-(2-ピリジルカルボニル)-2-ピラジニル
 1732 5-アセチル-2-ピリミジニル
 1733 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル
 1734 4-フェニル-2-ピリミジニル
 1735 5-フェニル-2-ピリミジニル
 1736 2-フェニル-4-ピリミジニル
 1737 6-フェニル-4-ピリミジニル
 1738 2-フェニル-5-ピリミジニル
 1739 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 1740 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 1741 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 1742 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 1743 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 1744 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 1745 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1746 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1747 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1748 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1749 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル

(表6の続き)

- 1750 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1751 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1752 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1753 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1754 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1755 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1756 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1757 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1758 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1759 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1760 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1761 5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1762 5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1763 6-フェニル-3-ピリダジニル
 1764 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
 1765 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
 1766 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
 1767 2-ベンゾチアゾリル
 1768 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
 1769 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
 1770 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
 1771 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
 1772 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
 1773 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
 1774 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
 1775 6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル
 1776 3-キノリル
 1777 6-キノリル
 1778 6-メチル-2-キノリル
 1779 7-メチル-2-キノリル
 1780 8-メチル-2-キノリル
 1781 2-メチル-6-キノリル
 1782 6-クロロ-2-キノキサリニル
 1783 7-クロロ-2-キノキサリニル
 1784 6-メチル-2-キノキサリニル
 1785 1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1786 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1787 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1788 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1789 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1790 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表7



No. Ar 1

- 1791 3-フルオロフェニル
- 1792 4-フルオロフェニル
- 1793 3, 4-ジフルオロフェニル
- 1794 3-クロロフェニル
- 1795 4-クロロフェニル
- 1796 3, 4-ジクロロフェニル
- 1797 4-アセチルフェニル
- 1798 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
- 1799 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
- 1800 2-ビフェニリル
- 1801 3-ビフェニリル
- 1802 4-ビフェニリル
- 1803 4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル
- 1804 4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル
- 1805 4-(2-チアゾリル)フェニル
- 1806 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル
- 1807 3-(2-ピリジル)フェニル
- 1808 3-(4-ピリジル)フェニル
- 1809 4-(2-ピリジル)フェニル

(表7の続き)

- 1810 4-(3-ピリジル)フェニル
 1811 4-(4-ピリジル)フェニル
 1812 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル
 1813 4-(4-ピリミジニル)フェニル
 1814 4-ベンゾイルフェニル
 1815 4-(2-ピリジルカルボニル)フェニル
 1816 1-ナフチル
 1817 9-オキソ-3-フルオレニル
 1818 1-メチル-2-イミダゾリル
 1819 1-フェニル-4-イミダゾリル
 1820 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1821 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1822 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1823 1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1824 1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1825 1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
 1826 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
 1827 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1828 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1829 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
 1830 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
 1831 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 1832 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
 1833 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1834 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1835 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1836 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
 1837 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル
 1838 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1839 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1840 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
 1841 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル
 1842 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル
 1843 1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル
 1844 1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル
 1845 1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル
 1846 1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル
 1847 1-フェニル-3-ピラゾリル
 1848 5-フェニル-3-ピラゾリル
 1849 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル

(表7の続き)

- 1850 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1851 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
 1852 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1853 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1854 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
 1855 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1856 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1857 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
 1858 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
 1859 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル
 1860 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル
 1861 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル
 1862 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル
 1863 2-エチル-4-チアゾリル
 1864 4-フェニル-2-チアゾリル
 1865 5-フェニル-2-チアゾリル
 1866 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 1867 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル
 1868 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル
 1869 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル
 1870 4-フェニル-2-オキサゾリル
 1871 5-フェニル-2-オキサゾリル
 1872 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1873 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1874 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
 1875 3-フェニル-5-イソオキサゾリル
 1876 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1877 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1878 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
 1879 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル
 1880 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
 1881 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1882 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1883 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1884 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
 1885 5-フェニル-2-ピリジル
 1886 5-フェニル-3-ピリジル
 1887 6-フェニル-3-ピリジル
 1888 2-フェニル-4-ピリジル
 1889 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル

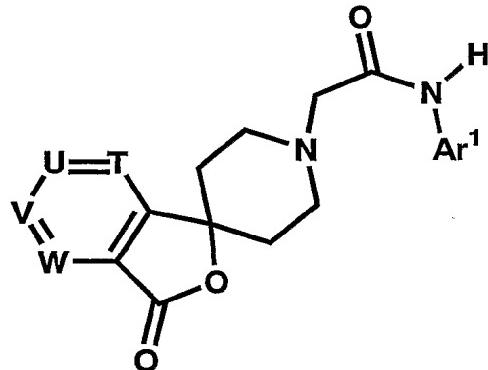
(表7の続き)

- 1890 5-ベンゾイル-2-ピリジル
 1891 6-ベンゾイル-3-ピリジル
 1892 5-クロロ-2-ピラジニル
 1893 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル
 1894 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
 1895 5-アセチル-2-ピラジニル
 1896 5-プロピオニル-2-ピラジニル
 1897 5-フェニル-2-ピラジニル
 1898 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
 1899 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
 1900 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
 1901 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
 1902 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
 1903 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
 1904 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
 1905 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル
 1906 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル
 1907 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル
 1908 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
 1909 5-ベンゾイル-2-ピラジニル
 1910 5-(2-ピリジルカルボニル)-2-ピラジニル
 1911 5-アセチル-2-ピリミジニル
 1912 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル
 1913 4-フェニル-2-ピリミジニル
 1914 5-フェニル-2-ピリミジニル
 1915 2-フェニル-4-ピリミジニル
 1916 6-フェニル-4-ピリミジニル
 1917 2-フェニル-5-ピリミジニル
 1918 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 1919 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 1920 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
 1921 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 1922 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 1923 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
 1924 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1925 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1926 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1927 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1928 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1929 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル

(表7の続き)

- 1930 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1931 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1932 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1933 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1934 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1935 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1936 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1937 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1938 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1939 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1940 5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
 1941 5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
 1942 6-フェニル-3-ピリダジニル
 1943 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
 1944 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
 1945 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
 1946 2-ベンゾチアゾリル
 1947 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
 1948 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
 1949 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
 1950 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
 1951 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
 1952 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
 1953 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
 1954 6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル
 1955 3-キノリル
 1956 6-キノリル
 1957 6-メチル-2-キノリル
 1958 7-メチル-2-キノリル
 1959 8-メチル-2-キノリル
 1960 2-メチル-6-キノリル
 1961 6-クロロ-2-キノキサリニル
 1962 7-クロロ-2-キノキサリニル
 1963 6-メチル-2-キノキサリニル
 1964 1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1965 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1966 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1967 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1968 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
 1969 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表8



| No. | T | U | V | W | Ar 1 |
|------|----|----|----|----|--------------------------------|
| 1970 | CH | CH | CH | CH | 3-フルオロフェニル |
| 1971 | CH | CH | CH | CH | 4-フルオロフェニル |
| 1972 | CH | CH | CH | CH | 3, 4-ジフルオロフェニル |
| 1973 | CH | CH | CH | CH | 3-クロロフェニル |
| 1974 | CH | CH | CH | CH | 4-クロロフェニル |
| 1975 | CH | CH | CH | CH | 3, 4-ジクロロフェニル |
| 1976 | CH | CH | CH | CH | 4-アセチルフェニル |
| 1977 | CH | CH | CH | CH | 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル |
| 1978 | CH | CH | CH | CH | 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル |
| 1979 | CH | CH | CH | CH | 2-ビフェニル |
| 1980 | CH | CH | CH | CH | 3-ビフェニル |
| 1981 | CH | CH | CH | CH | 4-ビフェニル |
| 1982 | CH | CH | CH | CH | 4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル |
| 1983 | CH | CH | CH | CH | 4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル |
| 1984 | CH | CH | CH | CH | 4-(2-チアゾリル)フェニル |
| 1985 | CH | CH | CH | CH | 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル |
| 1986 | CH | CH | CH | CH | 3-(2-ピリジル)フェニル |
| 1987 | CH | CH | CH | CH | 3-(4-ピリジル)フェニル |
| 1988 | CH | CH | CH | CH | 4-(2-ピリジル)フェニル |
| 1989 | CH | CH | CH | CH | 4-(3-ピリジル)フェニル |
| 1990 | CH | CH | CH | CH | 4-(4-ピリジル)フェニル |
| 1991 | CH | CH | CH | CH | 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル |
| 1992 | CH | CH | CH | CH | 4-(4-ピリミジニル)フェニル |
| 1993 | CH | CH | CH | CH | 4-ベンゾイルフェニル |
| 1994 | CH | CH | CH | CH | 4-(2-ピリジルカルボニル)フェニル |
| 1995 | CH | CH | CH | CH | 1-ナフチル |
| 1996 | CH | CH | CH | CH | 9-オキソ-3-フルオレニル |
| 1997 | CH | CH | CH | CH | 1-メチル-2-イミダゾリル |
| 1998 | CH | CH | CH | CH | 1-フェニル-4-イミダゾリル |
| 1999 | CH | CH | CH | CH | 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |

(表8の続き)

| | | | | |
|---------|----|----|----|--|
| 2000 CH | CH | CH | CH | 1 - (3-フルオロフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2001 CH | CH | CH | CH | 1 - (4-フルオロフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2002 CH | CH | CH | CH | 1 - (2, 3-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2003 CH | CH | CH | CH | 1 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2004 CH | CH | CH | CH | 1 - (3, 5-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2005 CH | CH | CH | CH | 1 - (3-クロロフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2006 CH | CH | CH | CH | 1 - (2-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2007 CH | CH | CH | CH | 1 - (3-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2008 CH | CH | CH | CH | 1 - (4-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2009 CH | CH | CH | CH | 1 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2010 CH | CH | CH | CH | 1 - [3 - (2-ヒドロキシエチル) フェニル] - 4-イミダゾリル |
| 2011 CH | CH | CH | CH | 1 - [3 - (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] - 4-イミダゾリル |
| 2012 CH | CH | CH | CH | 1 - (3-メトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2013 CH | CH | CH | CH | 1 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2014 CH | CH | CH | CH | 1 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2015 CH | CH | CH | CH | 1 - (4-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2016 CH | CH | CH | CH | 1 - (2-ピリジル) - 4-イミダゾリル |
| 2017 CH | CH | CH | CH | 1 - (4-ベンゾ[b]フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 2018 CH | CH | CH | CH | 1 - (5-ベンゾ[b]フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 2019 CH | CH | CH | CH | 1 - (7-ベンゾ[b]フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 2020 CH | CH | CH | CH | 1 - (2-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2021 CH | CH | CH | CH | 1 - (3-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2022 CH | CH | CH | CH | 1 - (4-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2023 CH | CH | CH | CH | 1 - (5-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2024 CH | CH | CH | CH | 1 - (6-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2025 CH | CH | CH | CH | 1 - (8-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2026 CH | CH | CH | CH | 1-フェニル-3-ピラゾリル |
| 2027 CH | CH | CH | CH | 5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 2028 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2029 CH | CH | CH | CH | 5 - (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2030 CH | CH | CH | CH | 5 - (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2031 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2032 CH | CH | CH | CH | 5 - (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2033 CH | CH | CH | CH | 5 - (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2034 CH | CH | CH | CH | 5 - (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2035 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2036 CH | CH | CH | CH | 5 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2037 CH | CH | CH | CH | 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 2038 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-ピリジル) - 3-ピラゾリル |
| 2039 CH | CH | CH | CH | 5 - (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ピラゾリル |

(表8の続き)

| | | | | |
|---------|----|----|----|---|
| 2040 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-キノリル) - 3-ピラゾリル |
| 2041 CH | CH | CH | CH | 5 - (3-キノリル) - 3-ピラゾリル |
| 2042 CH | CH | CH | CH | 2-エチル-4-チアゾリル |
| 2043 CH | CH | CH | CH | 4-フェニル-2-チアゾリル |
| 2044 CH | CH | CH | CH | 5-フェニル-2-チアゾリル |
| 2045 CH | CH | CH | CH | 5 - (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル |
| 2046 CH | CH | CH | CH | 5 - (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル |
| 2047 CH | CH | CH | CH | 5 - (4-メトキシフェニル) - 2-チアゾリル |
| 2048 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-ビリジル) - 2-チアゾリル |
| 2049 CH | CH | CH | CH | 4-フェニル-2-オキサゾリル |
| 2050 CH | CH | CH | CH | 5-フェニル-2-オキサゾリル |
| 2051 CH | CH | CH | CH | 4 - (3-メトキシフェニル) - 2-オキサゾリル |
| 2052 CH | CH | CH | CH | 4 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル |
| 2053 CH | CH | CH | CH | 4 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル |
| 2054 CH | CH | CH | CH | 3-フェニル-5-イソオキサゾリル |
| 2055 CH | CH | CH | CH | 3 - (2-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル |
| 2056 CH | CH | CH | CH | 3 - (3-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル |
| 2057 CH | CH | CH | CH | 3 - (4-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル |
| 2058 CH | CH | CH | CH | 3 - (2-ビリジル) - 5-イソオキサゾリル |
| 2059 CH | CH | CH | CH | 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル |
| 2060 CH | CH | CH | CH | 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2061 CH | CH | CH | CH | 5 - (3-クロロフェニル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2062 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-ビリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2063 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-エチル-4-ビリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2064 CH | CH | CH | CH | 5-フェニル-2-ビリジル |
| 2065 CH | CH | CH | CH | 5-フェニル-3-ビリジル |
| 2066 CH | CH | CH | CH | 6-フェニル-3-ビリジル |
| 2067 CH | CH | CH | CH | 2-フェニル-4-ビリジル |
| 2068 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-ビリジル) - 2-ビリジル |
| 2069 CH | CH | CH | CH | 5-ベンゾイル-2-ビリジル |
| 2070 CH | CH | CH | CH | 6-ベンゾイル-3-ビリジル |
| 2071 CH | CH | CH | CH | 5-クロロ-2-ピラジニル |
| 2072 CH | CH | CH | CH | 5 - (1-メチルビニル) - 2-ピラジニル |
| 2073 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-メチル-1-プロペニル) - 2-ピラジニル |
| 2074 CH | CH | CH | CH | 5-アセチル-2-ピラジニル |
| 2075 CH | CH | CH | CH | 5-プロピオニル-2-ピラジニル |
| 2076 CH | CH | CH | CH | 5-フェニル-2-ピラジニル |
| 2077 CH | CH | CH | CH | 5 - (3-フルオロフェニル) - 2-ピラジニル |
| 2078 CH | CH | CH | CH | 5 - (2-クロロフェニル) - 2-ピラジニル |
| 2079 CH | CH | CH | CH | 5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|----|----|--------------------------------------|
| 2080 | CH | CH | CH | CH | 5 - (4-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル |
| 2081 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-メトキシフェニル) - 2-ピラジニル |
| 2082 | CH | CH | CH | CH | 5 - (1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル) - 2-ピラジニル |
| 2083 | CH | CH | CH | CH | 5 - (1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル) - 2-ピラジニル |
| 2084 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-ピリジル) - 2-ピラジニル |
| 2085 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-ピリジル) - 2-ピラジニル |
| 2086 | CH | CH | CH | CH | 5 - (5-ピリミジニル) - 2-ピラジニル |
| 2087 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-キノリル) - 2-ピラジニル |
| 2088 | CH | CH | CH | CH | 5 - ベンゾイル-2-ピラジニル |
| 2089 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-ピリジルカルボニル) - 2-ピラジニル |
| 2090 | CH | CH | CH | CH | 5 - アセチル-2-ピリミジニル |
| 2091 | CH | CH | CH | CH | 5 - アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル |
| 2092 | CH | CH | CH | CH | 4-フェニル-2-ピリミジニル |
| 2093 | CH | CH | CH | CH | 5-フェニル-2-ピリミジニル |
| 2094 | CH | CH | CH | CH | 2-フェニル-4-ピリミジニル |
| 2095 | CH | CH | CH | CH | 6-フェニル-4-ピリミジニル |
| 2096 | CH | CH | CH | CH | 2-フェニル-5-ピリミジニル |
| 2097 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-フルオロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2098 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-フルオロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2099 | CH | CH | CH | CH | 5 - (4-フルオロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2100 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2101 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2102 | CH | CH | CH | CH | 5 - (4-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2103 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2104 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2105 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2106 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2107 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2108 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2109 | CH | CH | CH | CH | 5 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2110 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2111 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2112 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2113 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2114 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2115 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2116 | CH | CH | CH | CH | 5 - (4-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2117 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2118 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2119 | CH | CH | CH | CH | 5 - (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|----|----|-------------------------------------|
| 2120 | CH | CH | CH | CH | 5 - (3-フルオロー-5-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2121 | CH | CH | CH | CH | 6-フェニル-3-ピリダジニル |
| 2122 | CH | CH | CH | CH | 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル |
| 2123 | CH | CH | CH | CH | 5-クロロー-2-ベンゾオキサゾリル |
| 2124 | CH | CH | CH | CH | 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 2125 | CH | CH | CH | CH | 2-ベンゾチアゾリル |
| 2126 | CH | CH | CH | CH | 5-フルオロー-2-ベンゾチアゾリル |
| 2127 | CH | CH | CH | CH | 4-クロロー-2-ベンゾチアゾリル |
| 2128 | CH | CH | CH | CH | 6-クロロー-2-ベンゾチアゾリル |
| 2129 | CH | CH | CH | CH | 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル |
| 2130 | CH | CH | CH | CH | 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル |
| 2131 | CH | CH | CH | CH | 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2132 | CH | CH | CH | CH | 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2133 | CH | CH | CH | CH | 6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル |
| 2134 | CH | CH | CH | CH | 3-キノリル |
| 2135 | CH | CH | CH | CH | 6-キノリル |
| 2136 | CH | CH | CH | CH | 6-メチル-2-キノリル |
| 2137 | CH | CH | CH | CH | 7-メチル-2-キノリル |
| 2138 | CH | CH | CH | CH | 8-メチル-2-キノリル |
| 2139 | CH | CH | CH | CH | 2-メチル-6-キノリル |
| 2140 | CH | CH | CH | CH | 6-クロロー-2-キノキサリニル |
| 2141 | CH | CH | CH | CH | 7-クロロー-2-キノキサリニル |
| 2142 | CH | CH | CH | CH | 6-メチル-2-キノキサリニル |
| 2143 | CH | CH | CH | CH | 1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2144 | CH | CH | CH | CH | 7-クロロー-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2145 | CH | CH | CH | CH | 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2146 | CH | CH | CH | CH | 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2147 | CH | CH | CH | CH | 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2148 | CH | CH | CH | CH | 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2149 | N | CH | CH | CH | 3-フルオロフェニル |
| 2150 | N | CH | CH | CH | 4-フルオロフェニル |
| 2151 | N | CH | CH | CH | 3, 4-ジフルオロフェニル |
| 2152 | N | CH | CH | CH | 3-クロロフェニル |
| 2153 | N | CH | CH | CH | 4-クロロフェニル |
| 2154 | N | CH | CH | CH | 3, 4-ジクロロフェニル |
| 2155 | N | CH | CH | CH | 4-アセチルフェニル |
| 2156 | N | CH | CH | CH | 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロー-2-ナフチル |
| 2157 | N | CH | CH | CH | 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル |
| 2158 | N | CH | CH | CH | 2-ビフェニリル |
| 2159 | N | CH | CH | CH | 3-ビフェニリル |

(表8の続き)

| | | | | |
|--------|----|----|----|---------------------------------------|
| 2160 N | CH | CH | CH | 4-ビフェニル |
| 2161 N | CH | CH | CH | 4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル |
| 2162 N | CH | CH | CH | 4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル |
| 2163 N | CH | CH | CH | 4-(2-チアゾリル)フェニル |
| 2164 N | CH | CH | CH | 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル |
| 2165 N | CH | CH | CH | 3-(2-ピリジル)フェニル |
| 2166 N | CH | CH | CH | 3-(4-ピリジル)フェニル |
| 2167 N | CH | CH | CH | 4-(2-ピリジル)フェニル |
| 2168 N | CH | CH | CH | 4-(3-ピリジル)フェニル |
| 2169 N | CH | CH | CH | 4-(4-ピリジル)フェニル |
| 2170 N | CH | CH | CH | 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル |
| 2171 N | CH | CH | CH | 4-(4-ピリミジニル)フェニル |
| 2172 N | CH | CH | CH | 4-ベンゾイルフェニル |
| 2173 N | CH | CH | CH | 4-(2-ピリジカルボニル)フェニル |
| 2174 N | CH | CH | CH | 1-ナフチル |
| 2175 N | CH | CH | CH | 9-オキソ-3-フルオレニル |
| 2176 N | CH | CH | CH | 1-メチル-2-イミダゾリル |
| 2177 N | CH | CH | CH | 1-フェニル-4-イミダゾリル |
| 2178 N | CH | CH | CH | 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2179 N | CH | CH | CH | 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2180 N | CH | CH | CH | 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2181 N | CH | CH | CH | 1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2182 N | CH | CH | CH | 1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2183 N | CH | CH | CH | 1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2184 N | CH | CH | CH | 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2185 N | CH | CH | CH | 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2186 N | CH | CH | CH | 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2187 N | CH | CH | CH | 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2188 N | CH | CH | CH | 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2189 N | CH | CH | CH | 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル |
| 2190 N | CH | CH | CH | 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル |
| 2191 N | CH | CH | CH | 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2192 N | CH | CH | CH | 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2193 N | CH | CH | CH | 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2194 N | CH | CH | CH | 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2195 N | CH | CH | CH | 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル |
| 2196 N | CH | CH | CH | 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 2197 N | CH | CH | CH | 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 2198 N | CH | CH | CH | 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 2199 N | CH | CH | CH | 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル |

(表8 の続き)

| | | | | |
|--------|----|----|----|---------------------------------------|
| 2200 N | CH | CH | CH | 1 - (3 - キノリル) - 4 - イミダゾリル |
| 2201 N | CH | CH | CH | 1 - (4 - キノリル) - 4 - イミダゾリル |
| 2202 N | CH | CH | CH | 1 - (5 - キノリル) - 4 - イミダゾリル |
| 2203 N | CH | CH | CH | 1 - (6 - キノリル) - 4 - イミダゾリル |
| 2204 N | CH | CH | CH | 1 - (8 - キノリル) - 4 - イミダゾリル |
| 2205 N | CH | CH | CH | 1 - フェニル - 3 - ピラゾリル |
| 2206 N | CH | CH | CH | 5 - フェニル - 3 - ピラゾリル |
| 2207 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2208 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - フルオロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2209 N | CH | CH | CH | 5 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2210 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - クロロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2211 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - クロロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2212 N | CH | CH | CH | 5 - (4 - クロロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2213 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2214 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - ジフルオロメトキシフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2215 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - ジフルオロメトキシフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2216 N | CH | CH | CH | 2 - メチル - 5 - フェニル - 3 - ピラゾリル |
| 2217 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - ピリジル) - 3 - ピラゾリル |
| 2218 N | CH | CH | CH | 5 - (5 - メトキシ - 3 - ピリジル) - 3 - ピラゾリル |
| 2219 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - キノリル) - 3 - ピラゾリル |
| 2220 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - キノリル) - 3 - ピラゾリル |
| 2221 N | CH | CH | CH | 2 - エチル - 4 - チアゾリル |
| 2222 N | CH | CH | CH | 4 - フェニル - 2 - チアゾリル |
| 2223 N | CH | CH | CH | 5 - フェニル - 2 - チアゾリル |
| 2224 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - クロロフェニル) - 2 - チアゾリル |
| 2225 N | CH | CH | CH | 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - チアゾリル |
| 2226 N | CH | CH | CH | 5 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - チアゾリル |
| 2227 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - ピリジル) - 2 - チアゾリル |
| 2228 N | CH | CH | CH | 4 - フェニル - 2 - オキサゾリル |
| 2229 N | CH | CH | CH | 5 - フェニル - 2 - オキサゾリル |
| 2230 N | CH | CH | CH | 4 - (3 - メトキシフェニル) - 2 - オキサゾリル |
| 2231 N | CH | CH | CH | 4 - (2 - フルオロメトキシフェニル) - 2 - オキサゾリル |
| 2232 N | CH | CH | CH | 4 - (3 - フルオロメトキシフェニル) - 2 - オキサゾリル |
| 2233 N | CH | CH | CH | 3 - フェニル - 5 - イソオキサゾリル |
| 2234 N | CH | CH | CH | 3 - (2 - クロロフェニル) - 5 - イソオキサゾリル |
| 2235 N | CH | CH | CH | 3 - (3 - クロロフェニル) - 5 - イソオキサゾリル |
| 2236 N | CH | CH | CH | 3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - イソオキサゾリル |
| 2237 N | CH | CH | CH | 3 - (2 - ピリジル) - 5 - イソオキサゾリル |
| 2238 N | CH | CH | CH | 5 - フェニル - 1, 2, 4 - チアジアゾール - 3 - イル |
| 2239 N | CH | CH | CH | 5 - フェニル - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル |

(表8の続き)

| | | | | |
|--------|----|----|----|---|
| 2240 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - クロロフェニル) - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル |
| 2241 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - ピリジル) - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル |
| 2242 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - エチル - 4 - ピリジル) - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル |
| 2243 N | CH | CH | CH | 5 - フェニル - 2 - ピリジル |
| 2244 N | CH | CH | CH | 5 - フェニル - 3 - ピリジル |
| 2245 N | CH | CH | CH | 6 - フェニル - 3 - ピリジル |
| 2246 N | CH | CH | CH | 2 - フェニル - 4 - ピリジル |
| 2247 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - ピリジル) - 2 - ピリジル |
| 2248 N | CH | CH | CH | 5 - ベンゾイル - 2 - ピリジル |
| 2249 N | CH | CH | CH | 6 - ベンゾイル - 3 - ピリジル |
| 2250 N | CH | CH | CH | 5 - クロロ - 2 - ピラジニル |
| 2251 N | CH | CH | CH | 5 - (1 - メチルビニル) - 2 - ピラジニル |
| 2252 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - メチル - 1 - プロペニル) - 2 - ピラジニル |
| 2253 N | CH | CH | CH | 5 - アセチル - 2 - ピラジニル |
| 2254 N | CH | CH | CH | 5 - プロピオニル - 2 - ピラジニル |
| 2255 N | CH | CH | CH | 5 - フェニル - 2 - ピラジニル |
| 2256 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - フルオロフェニル) - 2 - ピラジニル |
| 2257 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - クロロフェニル) - 2 - ピラジニル |
| 2258 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - ヒドロキシフェニル) - 2 - ピラジニル |
| 2259 N | CH | CH | CH | 5 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 2 - ピラジニル |
| 2260 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - メトキシフェニル) - 2 - ピラジニル |
| 2261 N | CH | CH | CH | 5 - (1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル) - 2 - ピラジニル |
| 2262 N | CH | CH | CH | 5 - (1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 2 - ピラジニル |
| 2263 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - ピリジル) - 2 - ピラジニル |
| 2264 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - ピリジル) - 2 - ピラジニル |
| 2265 N | CH | CH | CH | 5 - (5 - ピリミジニル) - 2 - ピラジニル |
| 2266 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - キノリル) - 2 - ピラジニル |
| 2267 N | CH | CH | CH | 5 - ベンゾイル - 2 - ピラジニル |
| 2268 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - ピリジルカルボニル) - 2 - ピラジニル |
| 2269 N | CH | CH | CH | 5 - アセチル - 2 - ピリミジニル |
| 2270 N | CH | CH | CH | 5 - アセチル - 3 - メチル - 2 - ピリミジニル |
| 2271 N | CH | CH | CH | 4 - フェニル - 2 - ピリミジニル |
| 2272 N | CH | CH | CH | 5 - フェニル - 2 - ピリミジニル |
| 2273 N | CH | CH | CH | 2 - フェニル - 4 - ピリミジニル |
| 2274 N | CH | CH | CH | 6 - フェニル - 4 - ピリミジニル |
| 2275 N | CH | CH | CH | 2 - フェニル - 5 - ピリミジニル |
| 2276 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - ピリミジニル |
| 2277 N | CH | CH | CH | 5 - (3 - フルオロフェニル) - 2 - ピリミジニル |
| 2278 N | CH | CH | CH | 5 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - ピリミジニル |
| 2279 N | CH | CH | CH | 5 - (2 - クロロフェニル) - 2 - ピリミジニル |

(表8の続き)

| | | | | |
|--------|----|----|----|------------------------------------|
| 2280 N | CH | CH | CH | 5 - (3-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2281 N | CH | CH | CH | 5 - (4-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2282 N | CH | CH | CH | 5 - (2-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2283 N | CH | CH | CH | 5 - (3-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2284 N | CH | CH | CH | 5 - (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2285 N | CH | CH | CH | 5 - (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2286 N | CH | CH | CH | 5 - (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2287 N | CH | CH | CH | 5 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2288 N | CH | CH | CH | 5 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2289 N | CH | CH | CH | 5 - (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2290 N | CH | CH | CH | 5 - (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2291 N | CH | CH | CH | 5 - (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2292 N | CH | CH | CH | 5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2293 N | CH | CH | CH | 5 - (2-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2294 N | CH | CH | CH | 5 - (3-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2295 N | CH | CH | CH | 5 - (4-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2296 N | CH | CH | CH | 5 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2297 N | CH | CH | CH | 5 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2298 N | CH | CH | CH | 5 - (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2299 N | CH | CH | CH | 5 - (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2300 N | CH | CH | CH | 6-フェニル-3-ピリダジニル |
| 2301 N | CH | CH | CH | 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル |
| 2302 N | CH | CH | CH | 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 2303 N | CH | CH | CH | 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 2304 N | CH | CH | CH | 2-ベンゾチアゾリル |
| 2305 N | CH | CH | CH | 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2306 N | CH | CH | CH | 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2307 N | CH | CH | CH | 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2308 N | CH | CH | CH | 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル |
| 2309 N | CH | CH | CH | 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル |
| 2310 N | CH | CH | CH | 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2311 N | CH | CH | CH | 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2312 N | CH | CH | CH | 6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル |
| 2313 N | CH | CH | CH | 3-キノリル |
| 2314 N | CH | CH | CH | 6-キノリル |
| 2315 N | CH | CH | CH | 6-メチル-2-キノリル |
| 2316 N | CH | CH | CH | 7-メチル-2-キノリル |
| 2317 N | CH | CH | CH | 8-メチル-2-キノリル |
| 2318 N | CH | CH | CH | 2-メチル-6-キノリル |
| 2319 N | CH | CH | CH | 6-クロロ-2-キノキサリニル |

(表8の続き)

| | | | | |
|---------|----|----|----|--------------------------------|
| 2320 N | CH | CH | CH | 7-クロロ-2-キノキサリニル |
| 2321 N | CH | CH | CH | 6-メチル-2-キノキサリニル |
| 2322 N | CH | CH | CH | 1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2323 N | CH | CH | CH | 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2324 N | CH | CH | CH | 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2325 N | CH | CH | CH | 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2326 N | CH | CH | CH | 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2327 N | CH | CH | CH | 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2328 CH | N | CH | CH | 3-フルオロフェニル |
| 2329 CH | N | CH | CH | 4-フルオロフェニル |
| 2330 CH | N | CH | CH | 3, 4-ジフルオロフェニル |
| 2331 CH | N | CH | CH | 3-クロロフェニル |
| 2332 CH | N | CH | CH | 4-クロロフェニル |
| 2333 CH | N | CH | CH | 3, 4-ジクロロフェニル |
| 2334 CH | N | CH | CH | 4-アセチルフェニル |
| 2335 CH | N | CH | CH | 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル |
| 2336 CH | N | CH | CH | 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル |
| 2337 CH | N | CH | CH | 2-ビフェニリル |
| 2338 CH | N | CH | CH | 3-ビフェニリル |
| 2339 CH | N | CH | CH | 4-ビフェニリル |
| 2340 CH | N | CH | CH | 4- (1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル |
| 2341 CH | N | CH | CH | 4- (1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル |
| 2342 CH | N | CH | CH | 4- (2-チアゾリル) フェニル |
| 2343 CH | N | CH | CH | 4- (2-エチル-4-チアゾリル) フェニル |
| 2344 CH | N | CH | CH | 3- (2-ピリジル) フェニル |
| 2345 CH | N | CH | CH | 3- (4-ピリジル) フェニル |
| 2346 CH | N | CH | CH | 4- (2-ピリジル) フェニル |
| 2347 CH | N | CH | CH | 4- (3-ピリジル) フェニル |
| 2348 CH | N | CH | CH | 4- (4-ピリジル) フェニル |
| 2349 CH | N | CH | CH | 4- (2-エチル-4-ピリジル) フェニル |
| 2350 CH | N | CH | CH | 4- (4-ピリミジニル) フェニル |
| 2351 CH | N | CH | CH | 4-ベンゾイルフェニル |
| 2352 CH | N | CH | CH | 4- (2-ピリジカルボニル) フェニル |
| 2353 CH | N | CH | CH | 1-ナフチル |
| 2354 CH | N | CH | CH | 9-オキソ-3-フルオレニル |
| 2355 CH | N | CH | CH | 1-メチル-2-イミダゾリル |
| 2356 CH | N | CH | CH | 1-フェニル-4-イミダゾリル |
| 2357 CH | N | CH | CH | 1- (2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2358 CH | N | CH | CH | 1- (3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2359 CH | N | CH | CH | 1- (4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|---|----|----|--|
| 2360 | CH | N | CH | CH | 1 - (2, 3-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2361 | CH | N | CH | CH | 1 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2362 | CH | N | CH | CH | 1 - (3, 5-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2363 | CH | N | CH | CH | 1 - (3-クロロフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2364 | CH | N | CH | CH | 1 - (2-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2365 | CH | N | CH | CH | 1 - (3-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2366 | CH | N | CH | CH | 1 - (4-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2367 | CH | N | CH | CH | 1 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2368 | CH | N | CH | CH | 1 - [3 - (2-ヒドロキシエチル) フェニル] - 4-イミダゾリル |
| 2369 | CH | N | CH | CH | 1 - [3 - (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] - 4-イミダゾリル |
| 2370 | CH | N | CH | CH | 1 - (3-メトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2371 | CH | N | CH | CH | 1 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2372 | CH | N | CH | CH | 1 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2373 | CH | N | CH | CH | 1 - (4-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル |
| 2374 | CH | N | CH | CH | 1 - (2-ピリジル) - 4-イミダゾリル |
| 2375 | CH | N | CH | CH | 1 - (4-ベンゾ[b]フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 2376 | CH | N | CH | CH | 1 - (5-ベンゾ[b]フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 2377 | CH | N | CH | CH | 1 - (7-ベンゾ[b]フラニル) - 4-イミダゾリル |
| 2378 | CH | N | CH | CH | 1 - (2-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2379 | CH | N | CH | CH | 1 - (3-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2380 | CH | N | CH | CH | 1 - (4-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2381 | CH | N | CH | CH | 1 - (5-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2382 | CH | N | CH | CH | 1 - (6-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2383 | CH | N | CH | CH | 1 - (8-キノリル) - 4-イミダゾリル |
| 2384 | CH | N | CH | CH | 1-フェニル-3-ピラゾリル |
| 2385 | CH | N | CH | CH | 5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 2386 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2387 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2388 | CH | N | CH | CH | 5 - (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2389 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2390 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2391 | CH | N | CH | CH | 5 - (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2392 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2393 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2394 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル |
| 2395 | CH | N | CH | CH | 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 2396 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-ピリジル) - 3-ピラゾリル |
| 2397 | CH | N | CH | CH | 5 - (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ピラゾリル |
| 2398 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-キノリル) - 3-ピラゾリル |
| 2399 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-キノリル) - 3-ピラゾリル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|---|----|----|---------------------------------------|
| 2400 | CH | N | CH | CH | 2-エチル-4-チアゾリル |
| 2401 | CH | N | CH | CH | 4-フェニル-2-チアゾリル |
| 2402 | CH | N | CH | CH | 5-フェニル-2-チアゾリル |
| 2403 | CH | N | CH | CH | 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル |
| 2404 | CH | N | CH | CH | 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル |
| 2405 | CH | N | CH | CH | 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル |
| 2406 | CH | N | CH | CH | 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル |
| 2407 | CH | N | CH | CH | 4-フェニル-2-オキサゾリル |
| 2408 | CH | N | CH | CH | 5-フェニル-2-オキサゾリル |
| 2409 | CH | N | CH | CH | 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 2410 | CH | N | CH | CH | 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 2411 | CH | N | CH | CH | 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 2412 | CH | N | CH | CH | 3-フェニル-5-イソオキサゾリル |
| 2413 | CH | N | CH | CH | 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 2414 | CH | N | CH | CH | 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 2415 | CH | N | CH | CH | 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 2416 | CH | N | CH | CH | 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル |
| 2417 | CH | N | CH | CH | 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル |
| 2418 | CH | N | CH | CH | 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2419 | CH | N | CH | CH | 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2420 | CH | N | CH | CH | 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2421 | CH | N | CH | CH | 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2422 | CH | N | CH | CH | 5-フェニル-2-ピリジル |
| 2423 | CH | N | CH | CH | 5-フェニル-3-ピリジル |
| 2424 | CH | N | CH | CH | 6-フェニル-3-ピリジル |
| 2425 | CH | N | CH | CH | 2-フェニル-4-ピリジル |
| 2426 | CH | N | CH | CH | 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル |
| 2427 | CH | N | CH | CH | 5-ベンゾイル-2-ピリジル |
| 2428 | CH | N | CH | CH | 6-ベンゾイル-3-ピリジル |
| 2429 | CH | N | CH | CH | 5-クロロ-2-ピラジニル |
| 2430 | CH | N | CH | CH | 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル |
| 2431 | CH | N | CH | CH | 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル |
| 2432 | CH | N | CH | CH | 5-アセチル-2-ピラジニル |
| 2433 | CH | N | CH | CH | 5-プロピオニル-2-ピラジニル |
| 2434 | CH | N | CH | CH | 5-フェニル-2-ピラジニル |
| 2435 | CH | N | CH | CH | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル |
| 2436 | CH | N | CH | CH | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル |
| 2437 | CH | N | CH | CH | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 2438 | CH | N | CH | CH | 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 2439 | CH | N | CH | CH | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|---|----|----|--------------------------------------|
| 2440 | CH | N | CH | CH | 5 - (1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル) - 2-ピラジニル |
| 2441 | CH | N | CH | CH | 5 - (1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル) - 2-ピラジニル |
| 2442 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-ピリジル) - 2-ピラジニル |
| 2443 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-ピリジル) - 2-ピラジニル |
| 2444 | CH | N | CH | CH | 5 - (5-ピリミジニル) - 2-ピラジニル |
| 2445 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-キノリル) - 2-ピラジニル |
| 2446 | CH | N | CH | CH | 5 - ベンゾイル-2-ピラジニル |
| 2447 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-ピリジルカルボニル) - 2-ピラジニル |
| 2448 | CH | N | CH | CH | 5 - アセチル-2-ピリミジニル |
| 2449 | CH | N | CH | CH | 5 - アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル |
| 2450 | CH | N | CH | CH | 4-フェニル-2-ピリミジニル |
| 2451 | CH | N | CH | CH | 5-フェニル-2-ピリミジニル |
| 2452 | CH | N | CH | CH | 2-フェニル-4-ピリミジニル |
| 2453 | CH | N | CH | CH | 6-フェニル-4-ピリミジニル |
| 2454 | CH | N | CH | CH | 2-フェニル-5-ピリミジニル |
| 2455 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-フルオロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2456 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-フルオロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2457 | CH | N | CH | CH | 5 - (4-フルオロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2458 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2459 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2460 | CH | N | CH | CH | 5 - (4-クロロフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2461 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2462 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2463 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2464 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2465 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2466 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2467 | CH | N | CH | CH | 5 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2468 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2469 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2470 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2471 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2472 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2473 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2474 | CH | N | CH | CH | 5 - (4-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2475 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2476 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2477 | CH | N | CH | CH | 5 - (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2478 | CH | N | CH | CH | 5 - (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル |
| 2479 | CH | N | CH | CH | 6-フェニル-3-ピリダジニル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|----|----|--------------------------------|
| 2480 | CH | N | CH | CH | 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル |
| 2481 | CH | N | CH | CH | 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 2482 | CH | N | CH | CH | 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 2483 | CH | N | CH | CH | 2-ベンゾチアゾリル |
| 2484 | CH | N | CH | CH | 5-フルオロー-2-ベンゾチアゾリル |
| 2485 | CH | N | CH | CH | 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2486 | CH | N | CH | CH | 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2487 | CH | N | CH | CH | 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル |
| 2488 | CH | N | CH | CH | 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル |
| 2489 | CH | N | CH | CH | 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2490 | CH | N | CH | CH | 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2491 | CH | N | CH | CH | 6-メトキスピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル |
| 2492 | CH | N | CH | CH | 3-キノリル |
| 2493 | CH | N | CH | CH | 6-キノリル |
| 2494 | CH | N | CH | CH | 6-メチル-2-キノリル |
| 2495 | CH | N | CH | CH | 7-メチル-2-キノリル |
| 2496 | CH | N | CH | CH | 8-メチル-2-キノリル |
| 2497 | CH | N | CH | CH | 2-メチル-6-キノリル |
| 2498 | CH | N | CH | CH | 6-クロロ-2-キノキサリニル |
| 2499 | CH | N | CH | CH | 7-クロロ-2-キノキサリニル |
| 2500 | CH | N | CH | CH | 6-メチル-2-キノキサリニル |
| 2501 | CH | N | CH | CH | 1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2502 | CH | N | CH | CH | 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2503 | CH | N | CH | CH | 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2504 | CH | N | CH | CH | 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2505 | CH | N | CH | CH | 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2506 | CH | N | CH | CH | 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2507 | CH | N | CH | CH | 3-フルオロフェニル |
| 2508 | CH | N | CH | CH | 4-フルオロフェニル |
| 2509 | CH | N | CH | CH | 3, 4-ジフルオロフェニル |
| 2510 | CH | N | CH | CH | 3-クロロフェニル |
| 2511 | CH | N | CH | CH | 4-クロロフェニル |
| 2512 | CH | N | CH | CH | 3, 4-ジクロロフェニル |
| 2513 | CH | N | CH | CH | 4-アセチルフェニル |
| 2514 | CH | N | CH | CH | 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル |
| 2515 | CH | N | CH | CH | 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル |
| 2516 | CH | N | CH | CH | 2-ビフェニリル |
| 2517 | CH | N | CH | CH | 3-ビフェニリル |
| 2518 | CH | N | CH | CH | 4-ビフェニリル |
| 2519 | CH | CH | N | CH | 4- (1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|---|----|---|
| 2520 | CH | CH | N | CH | 4 - (1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル |
| 2521 | CH | CH | N | CH | 4 - (2-チアゾリル) フェニル |
| 2522 | CH | CH | N | CH | 4 - (2-エチル-4-チアゾリル) フェニル |
| 2523 | CH | CH | N | CH | 3 - (2-ピリジル) フェニル |
| 2524 | CH | CH | N | CH | 3 - (4-ピリジル) フェニル |
| 2525 | CH | CH | N | CH | 4 - (2-ピリジル) フェニル |
| 2526 | CH | CH | N | CH | 4 - (3-ピリジル) フェニル |
| 2527 | CH | CH | N | CH | 4 - (4-ピリジル) フェニル |
| 2528 | CH | CH | N | CH | 4 - (2-エチル-4-ピリジル) フェニル |
| 2529 | CH | CH | N | CH | 4 - (4-ピリミジニル) フェニル |
| 2530 | CH | CH | N | CH | 4-ベンゾイルフェニル |
| 2531 | CH | CH | N | CH | 4 - (2-ピリジルカルボニル) フェニル |
| 2532 | CH | CH | N | CH | 1-ナフチル |
| 2533 | CH | CH | N | CH | 9-オキソ-3-フルオレニル |
| 2534 | CH | CH | N | CH | 1-メチル-2-イミダゾリル |
| 2535 | CH | CH | N | CH | 1-フェニル-4-イミダゾリル |
| 2536 | CH | CH | N | CH | 1 - (2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2537 | CH | CH | N | CH | 1 - (3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2538 | CH | CH | N | CH | 1 - (4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2539 | CH | CH | N | CH | 1 - (2, 3-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2540 | CH | CH | N | CH | 1 - (2, 4-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2541 | CH | CH | N | CH | 1 - (3, 5-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2542 | CH | CH | N | CH | 1 - (3-クロロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2543 | CH | CH | N | CH | 1 - (2-シアノフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2544 | CH | CH | N | CH | 1 - (3-シアノフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2545 | CH | CH | N | CH | 1 - (4-シアノフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2546 | CH | CH | N | CH | 1 - (3-トリフルオロメチルフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2547 | CH | CH | N | CH | 1 - [3 - (2-ヒドロキシエチル) フェニル] -4-イミダゾリル |
| 2548 | CH | CH | N | CH | 1 - [3 - (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] -4-イミダゾリル |
| 2549 | CH | CH | N | CH | 1 - (3-メトキシフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2550 | CH | CH | N | CH | 1 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2551 | CH | CH | N | CH | 1 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2552 | CH | CH | N | CH | 1 - (4-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2553 | CH | CH | N | CH | 1 - (2-ピリジル) -4-イミダゾリル |
| 2554 | CH | CH | N | CH | 1 - (4-ベンゾ[b]フラニル) -4-イミダゾリル |
| 2555 | CH | CH | N | CH | 1 - (5-ベンゾ[b]フラニル) -4-イミダゾリル |
| 2556 | CH | CH | N | CH | 1 - (7-ベンゾ[b]フラニル) -4-イミダゾリル |
| 2557 | CH | CH | N | CH | 1 - (2-キノリル) -4-イミダゾリル |
| 2558 | CH | CH | N | CH | 1 - (3-キノリル) -4-イミダゾリル |
| 2559 | CH | CH | N | CH | 1 - (4-キノリル) -4-イミダゾリル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|---|----|--|
| 2560 | CH | CH | N | CH | 1 - (5 - キノリル) - 4 - イミダゾリル |
| 2561 | CH | CH | N | CH | 1 - (6 - キノリル) - 4 - イミダゾリル |
| 2562 | CH | CH | N | CH | 1 - (8 - キノリル) - 4 - イミダゾリル |
| 2563 | CH | CH | N | CH | 1 - フェニル - 3 - ピラゾリル |
| 2564 | CH | CH | N | CH | 5 - フェニル - 3 - ピラゾリル |
| 2565 | CH | CH | N | CH | 5 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2566 | CH | CH | N | CH | 5 - (3 - フルオロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2567 | CH | CH | N | CH | 5 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2568 | CH | CH | N | CH | 5 - (2 - クロロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2569 | CH | CH | N | CH | 5 - (3 - クロロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2570 | CH | CH | N | CH | 5 - (4 - クロロフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2571 | CH | CH | N | CH | 5 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2572 | CH | CH | N | CH | 5 - (2 - ジフルオロメトキシフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2573 | CH | CH | N | CH | 5 - (3 - ジフルオロメトキシフェニル) - 3 - ピラゾリル |
| 2574 | CH | CH | N | CH | 2 - メチル - 5 - フェニル - 3 - ピラゾリル |
| 2575 | CH | CH | N | CH | 5 - (2 - ピリジル) - 3 - ピラゾリル |
| 2576 | CH | CH | N | CH | 5 - (5 - メトキシ - 3 - ピリジル) - 3 - ピラゾリル |
| 2577 | CH | CH | N | CH | 5 - (2 - キノリル) - 3 - ピラゾリル |
| 2578 | CH | CH | N | CH | 5 - (3 - キノリル) - 3 - ピラゾリル |
| 2579 | CH | CH | N | CH | 2 - エチル - 4 - チアゾリル |
| 2580 | CH | CH | N | CH | 4 - フェニル - 2 - チアゾリル |
| 2581 | CH | CH | N | CH | 5 - フェニル - 2 - チアゾリル |
| 2582 | CH | CH | N | CH | 5 - (3 - クロロフェニル) - 2 - チアゾリル |
| 2583 | CH | CH | N | CH | 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - チアゾリル |
| 2584 | CH | CH | N | CH | 5 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - チアゾリル |
| 2585 | CH | CH | N | CH | 5 - (2 - ピリジル) - 2 - チアゾリル |
| 2586 | CH | CH | N | CH | 4 - フェニル - 2 - オキサゾリル |
| 2587 | CH | CH | N | CH | 5 - フェニル - 2 - オキサゾリル |
| 2588 | CH | CH | N | CH | 4 - (3 - メトキシフェニル) - 2 - オキサゾリル |
| 2589 | CH | CH | N | CH | 4 - (2 - フルオロメトキシフェニル) - 2 - オキサゾリル |
| 2590 | CH | CH | N | CH | 4 - (3 - フルオロメトキシフェニル) - 2 - オキサゾリル |
| 2591 | CH | CH | N | CH | 3 - フェニル - 5 - イソオキサゾリル |
| 2592 | CH | CH | N | CH | 3 - (2 - クロロフェニル) - 5 - イソオキサゾリル |
| 2593 | CH | CH | N | CH | 3 - (3 - クロロフェニル) - 5 - イソオキサゾリル |
| 2594 | CH | CH | N | CH | 3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - イソオキサゾリル |
| 2595 | CH | CH | N | CH | 3 - (2 - ピリジル) - 5 - イソオキサゾリル |
| 2596 | CH | CH | N | CH | 5 - フェニル - 1, 2, 4 - チアジアゾール - 3 - イル |
| 2597 | CH | CH | N | CH | 5 - フェニル - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル |
| 2598 | CH | CH | N | CH | 5 - (3 - クロロフェニル) - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル |
| 2599 | CH | CH | N | CH | 5 - (2 - ピリジル) - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|---|----|-------------------------------------|
| 2600 | CH | CH | N | CH | 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル |
| 2601 | CH | CH | N | CH | 5-フェニル-2-ピリジル |
| 2602 | CH | CH | N | CH | 5-フェニル-3-ピリジル |
| 2603 | CH | CH | N | CH | 6-フェニル-3-ピリジル |
| 2604 | CH | CH | N | CH | 2-フェニル-4-ピリジル |
| 2605 | CH | CH | N | CH | 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル |
| 2606 | CH | CH | N | CH | 5-ベンゾイル-2-ピリジル |
| 2607 | CH | CH | N | CH | 6-ベンゾイル-3-ピリジル |
| 2608 | CH | CH | N | CH | 5-クロロ-2-ピラジニル |
| 2609 | CH | CH | N | CH | 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル |
| 2610 | CH | CH | N | CH | 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル |
| 2611 | CH | CH | N | CH | 5-アセチル-2-ピラジニル |
| 2612 | CH | CH | N | CH | 5-プロピオニル-2-ピラジニル |
| 2613 | CH | CH | N | CH | 5-フェニル-2-ピラジニル |
| 2614 | CH | CH | N | CH | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル |
| 2615 | CH | CH | N | CH | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル |
| 2616 | CH | CH | N | CH | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 2617 | CH | CH | N | CH | 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 2618 | CH | CH | N | CH | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 2619 | CH | CH | N | CH | 5-(1,2,4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル |
| 2620 | CH | CH | N | CH | 5-(1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル |
| 2621 | CH | CH | N | CH | 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 2622 | CH | CH | N | CH | 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 2623 | CH | CH | N | CH | 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル |
| 2624 | CH | CH | N | CH | 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル |
| 2625 | CH | CH | N | CH | 5-ベンゾイル-2-ピラジニル |
| 2626 | CH | CH | N | CH | 5-(2-ピリジルカルボニル)-2-ピラジニル |
| 2627 | CH | CH | N | CH | 5-アセチル-2-ピリミジニル |
| 2628 | CH | CH | N | CH | 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル |
| 2629 | CH | CH | N | CH | 4-フェニル-2-ピリミジニル |
| 2630 | CH | CH | N | CH | 5-フェニル-2-ピリミジニル |
| 2631 | CH | CH | N | CH | 2-フェニル-4-ピリミジニル |
| 2632 | CH | CH | N | CH | 6-フェニル-4-ピリミジニル |
| 2633 | CH | CH | N | CH | 2-フェニル-5-ピリミジニル |
| 2634 | CH | CH | N | CH | 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2635 | CH | CH | N | CH | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2636 | CH | CH | N | CH | 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2637 | CH | CH | N | CH | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2638 | CH | CH | N | CH | 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2639 | CH | CH | N | CH | 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|---|----|--------------------------------|
| 2640 | CH | CH | N | CH | 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2641 | CH | CH | N | CH | 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2642 | CH | CH | N | CH | 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2643 | CH | CH | N | CH | 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2644 | CH | CH | N | CH | 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2645 | CH | CH | N | CH | 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2646 | CH | CH | N | CH | 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2647 | CH | CH | N | CH | 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2648 | CH | CH | N | CH | 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2649 | CH | CH | N | CH | 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2650 | CH | CH | N | CH | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2651 | CH | CH | N | CH | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2652 | CH | CH | N | CH | 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2653 | CH | CH | N | CH | 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2654 | CH | CH | N | CH | 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2655 | CH | CH | N | CH | 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2656 | CH | CH | N | CH | 5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2657 | CH | CH | N | CH | 5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2658 | CH | CH | N | CH | 6-フェニル-3-ピリダジニル |
| 2659 | CH | CH | N | CH | 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル |
| 2660 | CH | CH | N | CH | 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 2661 | CH | CH | N | CH | 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 2662 | CH | CH | N | CH | 2-ベンゾチアゾリル |
| 2663 | CH | CH | N | CH | 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2664 | CH | CH | N | CH | 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2665 | CH | CH | N | CH | 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2666 | CH | CH | N | CH | 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル |
| 2667 | CH | CH | N | CH | 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル |
| 2668 | CH | CH | N | CH | 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2669 | CH | CH | N | CH | 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2670 | CH | CH | N | CH | 6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル |
| 2671 | CH | CH | N | CH | 3-キノリル |
| 2672 | CH | CH | N | CH | 6-キノリル |
| 2673 | CH | CH | N | CH | 6-メチル-2-キノリル |
| 2674 | CH | CH | N | CH | 7-メチル-2-キノリル |
| 2675 | CH | CH | N | CH | 8-メチル-2-キノリル |
| 2676 | CH | CH | N | CH | 2-メチル-6-キノリル |
| 2677 | CH | CH | N | CH | 6-クロロ-2-キノキサリニル |
| 2678 | CH | CH | N | CH | 7-クロロ-2-キノキサリニル |
| 2679 | CH | CH | N | CH | 6-メチル-2-キノキサリニル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|----|----|--------------------------------|
| 2680 | CH | CH | N | CH | 1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2681 | CH | CH | N | CH | 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2682 | CH | CH | N | CH | 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2683 | CH | CH | N | CH | 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2684 | CH | CH | N | CH | 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2685 | CH | CH | N | CH | 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2686 | CH | CH | CH | N | 3-フルオロフェニル |
| 2687 | CH | CH | CH | N | 4-フルオロフェニル |
| 2688 | CH | CH | CH | N | 3, 4-ジフルオロフェニル |
| 2689 | CH | CH | CH | N | 3-クロロフェニル |
| 2690 | CH | CH | CH | N | 4-クロロフェニル |
| 2691 | CH | CH | CH | N | 3, 4-ジクロロフェニル |
| 2692 | CH | CH | CH | N | 4-アセチルフェニル |
| 2693 | CH | CH | CH | N | 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル |
| 2694 | CH | CH | CH | N | 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル |
| 2695 | CH | CH | CH | N | 2-ビフェニリル |
| 2696 | CH | CH | CH | N | 3-ビフェニリル |
| 2697 | CH | CH | CH | N | 4-ビフェニリル |
| 2698 | CH | CH | CH | N | 4- (1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル |
| 2699 | CH | CH | CH | N | 4- (1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル |
| 2700 | CH | CH | CH | N | 4- (2-チアゾリル) フェニル |
| 2701 | CH | CH | CH | N | 4- (2-エチル-4-チアゾリル) フェニル |
| 2702 | CH | CH | CH | N | 3- (2-ピリジル) フェニル |
| 2703 | CH | CH | CH | N | 3- (4-ピリジル) フェニル |
| 2704 | CH | CH | CH | N | 4- (2-ピリジル) フェニル |
| 2705 | CH | CH | CH | N | 4- (3-ピリジル) フェニル |
| 2706 | CH | CH | CH | N | 4- (4-ピリジル) フェニル |
| 2707 | CH | CH | CH | N | 4- (2-エチル-4-ピリジル) フェニル |
| 2708 | CH | CH | CH | N | 4- (4-ピリミジニル) フェニル |
| 2709 | CH | CH | CH | N | 4-ベンゾイルフェニル |
| 2710 | CH | CH | CH | N | 4- (2-ピリジルカルボニル) フェニル |
| 2711 | CH | CH | CH | N | 1-ナフチル |
| 2712 | CH | CH | CH | N | 9-オキソ-3-フルオレニル |
| 2713 | CH | CH | CH | N | 1-メチル-2-イミダゾリル |
| 2714 | CH | CH | CH | N | 1-フェニル-4-イミダゾリル |
| 2715 | CH | CH | CH | N | 1- (2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2716 | CH | CH | CH | N | 1- (3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2717 | CH | CH | CH | N | 1- (4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2718 | CH | CH | CH | N | 1- (2, 3-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル |
| 2719 | CH | CH | CH | N | 1- (2, 4-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|----|---|---------------------------------------|
| 2720 | CH | CH | CH | N | 1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2721 | CH | CH | CH | N | 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2722 | CH | CH | CH | N | 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2723 | CH | CH | CH | N | 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2724 | CH | CH | CH | N | 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2725 | CH | CH | CH | N | 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2726 | CH | CH | CH | N | 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル |
| 2727 | CH | CH | CH | N | 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル |
| 2728 | CH | CH | CH | N | 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2729 | CH | CH | CH | N | 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2730 | CH | CH | CH | N | 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2731 | CH | CH | CH | N | 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル |
| 2732 | CH | CH | CH | N | 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル |
| 2733 | CH | CH | CH | N | 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 2734 | CH | CH | CH | N | 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 2735 | CH | CH | CH | N | 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル |
| 2736 | CH | CH | CH | N | 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 2737 | CH | CH | CH | N | 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 2738 | CH | CH | CH | N | 1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 2739 | CH | CH | CH | N | 1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 2740 | CH | CH | CH | N | 1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 2741 | CH | CH | CH | N | 1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル |
| 2742 | CH | CH | CH | N | 1-フェニル-3-ピラゾリル |
| 2743 | CH | CH | CH | N | 5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 2744 | CH | CH | CH | N | 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 2745 | CH | CH | CH | N | 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 2746 | CH | CH | CH | N | 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 2747 | CH | CH | CH | N | 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 2748 | CH | CH | CH | N | 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 2749 | CH | CH | CH | N | 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル |
| 2750 | CH | CH | CH | N | 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 2751 | CH | CH | CH | N | 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 2752 | CH | CH | CH | N | 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル |
| 2753 | CH | CH | CH | N | 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル |
| 2754 | CH | CH | CH | N | 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル |
| 2755 | CH | CH | CH | N | 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル |
| 2756 | CH | CH | CH | N | 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル |
| 2757 | CH | CH | CH | N | 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル |
| 2758 | CH | CH | CH | N | 2-エチル-4-チアゾリル |
| 2759 | CH | CH | CH | N | 4-フェニル-2-チアゾリル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|----|---|---------------------------------------|
| 2760 | CH | CH | CH | N | 5-フェニル-2-チアゾリル |
| 2761 | CH | CH | CH | N | 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル |
| 2762 | CH | CH | CH | N | 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル |
| 2763 | CH | CH | CH | N | 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル |
| 2764 | CH | CH | CH | N | 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル |
| 2765 | CH | CH | CH | N | 4-フェニル-2-オキサゾリル |
| 2766 | CH | CH | CH | N | 5-フェニル-2-オキサゾリル |
| 2767 | CH | CH | CH | N | 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 2768 | CH | CH | CH | N | 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 2769 | CH | CH | CH | N | 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル |
| 2770 | CH | CH | CH | N | 3-フェニル-5-イソオキサゾリル |
| 2771 | CH | CH | CH | N | 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 2772 | CH | CH | CH | N | 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 2773 | CH | CH | CH | N | 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル |
| 2774 | CH | CH | CH | N | 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル |
| 2775 | CH | CH | CH | N | 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル |
| 2776 | CH | CH | CH | N | 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2777 | CH | CH | CH | N | 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2778 | CH | CH | CH | N | 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2779 | CH | CH | CH | N | 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル |
| 2780 | CH | CH | CH | N | 5-フェニル-2-ピリジル |
| 2781 | CH | CH | CH | N | 5-フェニル-3-ピリジル |
| 2782 | CH | CH | CH | N | 6-フェニル-3-ピリジル |
| 2783 | CH | CH | CH | N | 2-フェニル-4-ピリジル |
| 2784 | CH | CH | CH | N | 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル |
| 2785 | CH | CH | CH | N | 5-ベンゾイル-2-ピリジル |
| 2786 | CH | CH | CH | N | 6-ベンゾイル-3-ピリジル |
| 2787 | CH | CH | CH | N | 5-クロロ-2-ピラジニル |
| 2788 | CH | CH | CH | N | 5-(1-メチルビニル)-2-ピラジニル |
| 2789 | CH | CH | CH | N | 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル |
| 2790 | CH | CH | CH | N | 5-アセチル-2-ピラジニル |
| 2791 | CH | CH | CH | N | 5-プロピオニル-2-ピラジニル |
| 2792 | CH | CH | CH | N | 5-フェニル-2-ピラジニル |
| 2793 | CH | CH | CH | N | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル |
| 2794 | CH | CH | CH | N | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル |
| 2795 | CH | CH | CH | N | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 2796 | CH | CH | CH | N | 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 2797 | CH | CH | CH | N | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル |
| 2798 | CH | CH | CH | N | 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル |
| 2799 | CH | CH | CH | N | 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|----|---|--------------------------------|
| 2800 | CH | CH | CH | N | 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 2801 | CH | CH | CH | N | 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル |
| 2802 | CH | CH | CH | N | 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル |
| 2803 | CH | CH | CH | N | 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル |
| 2804 | CH | CH | CH | N | 5-ベンゾイル-2-ピラジニル |
| 2805 | CH | CH | CH | N | 5-(2-ピリジルカルボニル)-2-ピラジニル |
| 2806 | CH | CH | CH | N | 5-アセチル-2-ピリミジニル |
| 2807 | CH | CH | CH | N | 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル |
| 2808 | CH | CH | CH | N | 4-フェニル-2-ピリミジニル |
| 2809 | CH | CH | CH | N | 5-フェニル-2-ピリミジニル |
| 2810 | CH | CH | CH | N | 2-フェニル-4-ピリミジニル |
| 2811 | CH | CH | CH | N | 6-フェニル-4-ピリミジニル |
| 2812 | CH | CH | CH | N | 2-フェニル-5-ピリミジニル |
| 2813 | CH | CH | CH | N | 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2814 | CH | CH | CH | N | 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2815 | CH | CH | CH | N | 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2816 | CH | CH | CH | N | 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2817 | CH | CH | CH | N | 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2818 | CH | CH | CH | N | 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2819 | CH | CH | CH | N | 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2820 | CH | CH | CH | N | 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2821 | CH | CH | CH | N | 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2822 | CH | CH | CH | N | 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2823 | CH | CH | CH | N | 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2824 | CH | CH | CH | N | 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2825 | CH | CH | CH | N | 5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2826 | CH | CH | CH | N | 5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2827 | CH | CH | CH | N | 5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2828 | CH | CH | CH | N | 5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2829 | CH | CH | CH | N | 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2830 | CH | CH | CH | N | 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2831 | CH | CH | CH | N | 5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2832 | CH | CH | CH | N | 5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2833 | CH | CH | CH | N | 5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2834 | CH | CH | CH | N | 5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2835 | CH | CH | CH | N | 5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2836 | CH | CH | CH | N | 5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル |
| 2837 | CH | CH | CH | N | 6-フェニル-3-ピリダジニル |
| 2838 | CH | CH | CH | N | 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル |
| 2839 | CH | CH | CH | N | 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル |

(表8の続き)

| | | | | | |
|------|----|----|----|---|-------------------------------|
| 2840 | CH | CH | CH | N | 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル |
| 2841 | CH | CH | CH | N | 2-ベンゾチアゾリル |
| 2842 | CH | CH | CH | N | 5-フルオロー-2-ベンゾチアゾリル |
| 2843 | CH | CH | CH | N | 4-クロロー-2-ベンゾチアゾリル |
| 2844 | CH | CH | CH | N | 6-クロロー-2-ベンゾチアゾリル |
| 2845 | CH | CH | CH | N | 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル |
| 2846 | CH | CH | CH | N | 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル |
| 2847 | CH | CH | CH | N | 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2848 | CH | CH | CH | N | 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル |
| 2849 | CH | CH | CH | N | 6-メトキスピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル |
| 2850 | CH | CH | CH | N | 3-キノリル |
| 2851 | CH | CH | CH | N | 6-キノリル |
| 2852 | CH | CH | CH | N | 6-メチル-2-キノリル |
| 2853 | CH | CH | CH | N | 7-メチル-2-キノリル |
| 2854 | CH | CH | CH | N | 8-メチル-2-キノリル |
| 2855 | CH | CH | CH | N | 2-メチル-6-キノリル |
| 2856 | CH | CH | CH | N | 6-クロロー-2-キノキサリニル |
| 2857 | CH | CH | CH | N | 7-クロロー-2-キノキサリニル |
| 2858 | CH | CH | CH | N | 6-メチル-2-キノキサリニル |
| 2859 | CH | CH | CH | N | 1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2860 | CH | CH | CH | N | 7-クロロー-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2861 | CH | CH | CH | N | 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2862 | CH | CH | CH | N | 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2863 | CH | CH | CH | N | 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル |
| 2864 | CH | CH | CH | N | 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル |

中でも、例えば、N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

5 N-(2-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

N-(3-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

N-(4-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

10 N-(5-ベンゾイル-2-ピリジル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

N-(3-クロロフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

- N-(4-クロロフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-2-チアゾリル)アセトアミド、
 5 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)アセトアミド、
 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-2-ピラジニル)アセトアミド、
 10 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(4-フェニル-2-チアゾリル)アセトアミド、
 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)アセトアミド、
 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(2-フェニル-4-ピリミジニル)アセトアミド、
 15 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(4-フェニル-2-ピリミジニル)アセトアミド、
 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(1-フェニル-4-イミダゾリル)アセトアミド、
 20 N-(6-メトキシ-7-アザベンゾチアゾール-2-イル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
 N-(2-ベンゾチアゾリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
 25 N-(6-メチル-2-キノリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
 N-(4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
 N-(6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

ピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] アセトアミド、
 2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] -N-(1-ナフチル) アセトアミド、
 N-(5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル)-2-[1-メチルスルホニル
 5 スピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] アセトアミド、
 N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-エチルスルホニルスピロ [イン
 ドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] アセトアミド、
 N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-アセチルスピロ [インドリン-
 10 3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] アセトアミド、
 N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [7-
 アザインドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] アセトアミド、
 N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[2-ヒドロキシ-1-メチルスルホ
 ニルスピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] アセトアミド、
 N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピ
 15 ロ [イソキノリン-1(2H), 4'-ピペリジン]-1'-イル] アセトアミ
 ド、
 2-[3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピロ [イソキノリン-1(2H), 4'
 -ピペリジン]-1'-イル] -N-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)
) アセトアミド、
 20 2-[3-オキソスピロ [イソベンゾフラン-1(3H), 4'-ピペリジン]
]-1'-イル] -N-(2-フェニル-4-ピリジル) アセトアミド、
 2-[3-オキソスピロ [6-アザイソベンゾフラン-1(3H), 4'-ピ
 ペリジン]-1'-イル] -N-(2-フェニル-4-ピリジル) アセトアミド、
 2-[3-オキソスピロ [イソベンゾフラン-1(3H), 4'-ピペリジン
 25]-1'-イル] -N-(1-フェニル-3-ピラゾリル) アセトアミド、
 N-(3-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン
 -3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] -2-フェニルアセトアミド、
 N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [イン
 ドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] プロピオニアミド、

2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] - N - (1 - フェニル - 4 - イミダゾリル) プロピオンアミド、

N - (3 - ビフェニリル) - 2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] ブチルアミド、

5 N - (4 - ベンゾイルフェニル) - 2 - メチル - 2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] プロピオンアミド、

N - (3 - ビフェニリル) - 2 - メチル - 2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] プロピオンアミド、

2 - メチル - 2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ピ

10 ペリジン] - 1' - イル] - N - (5 - フェニル - 3 - ピリジル) プロピオンアミド、

2 - メチル - 2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] - N - (3 - フェニル - 5 - イソオキサゾリル) プロピオンアミド又は

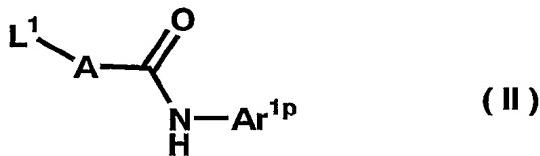
15 N - (4 - ベンゾイルフェニル) - 3 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] プロピオンアミド等が好適である。

次に、本発明に係る化合物の製造法について説明する。

本発明化合物 (I) は、例えば下記の製造法又は実施例に示す方法等により製
20 造することができる。ただし、本発明化合物 (I) の製造法はこれら反応例に限定されるものではない。

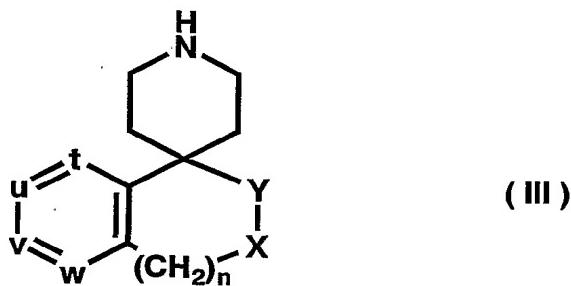
製造法 1

一般式 (II)

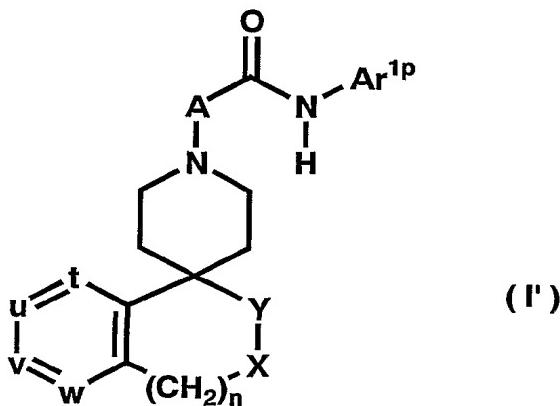


25 [式中、Ar^{1p}はハロゲン原子、ニトロ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボ

ニル基及び $-Q^p-Ar^{2p}$ で表される基並びに保護されていてもよい、オキソ基、
ヒドロキシ低級アルキル基及びカルボキシリル基からなる群より選択される置換基
を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； Ar^{2p} はハロ
ゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルコキシ基、
5 ハロ低級アルコキシ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリ
ール基並びに保護されていてもよい、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基及び低
級アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリ
ール基又はヘテロアリール基を意味し； L^1 は脱離基を意味し； Q^p は単結合又は
保護されていてもよいカルボニル基を意味し、 A は前記の意味を有する]で表さ
10 れる化合物と、一般式(III)



[式中、 t 、 u 、 v 及び w は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル
基及び低級アルコキシ基並びに保護されていてもよい水酸基からなる群より選択
される置換基を有していてもよいメチル基又は窒素原子であって、それらのうち
15 少なくとも2つが該メチル基を意味し、 n 、 X 及び Y は前記の意味を有する]で
表される化合物とを反応させ、一般式(I')



[式中、 A 、 Ar^{1p} 、 n 、 t 、 u 、 v 、 w 、 X 及び Y は前記の意味を有する]で
表される化合物とし、所望により保護基を除去することにより、一般式(I)で

表される化合物を製造することができる。

L¹で示される脱離基としては、例えば塩素原子、臭素原子若しくはヨウ素原子等のハロゲン原子、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基等の有機スルホニル基又はメタンスルホニルオキシ基、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基、p-トルエンスルホニルオキシ基等の有機スルホニルオキシ基等が挙げられる。

上記反応において、反応物質中に反応に関与しないアミノ基、水酸基、カルボキシル基、オキソ基、カルボニル基等が存在する場合、当該アミノ基、水酸基、カルボキシル基、オキソ基、カルボニル基は、適宜、アミノ基の保護基、水酸基の保護基、カルボキシル基の保護基又はオキソ基若しくはカルボニル基の保護基で保護した後に反応を行い、反応後に当該保護基を除去することができる。

「アミノ基の保護基」としては、例えばベンジル基、p-メトキシベンジル基、3, 4-ジメトキシベンジル基、o-ニトロベンジル基、p-ニトロベンジル基、ベンズヒドリル基、トリチル基等のアラルキル基；例えばホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、ピバロイル基等の低級アルカノイル基；例えばベンゾイル基；例えばフェニルアセチル基、フェノキシアセチル基等のアリールアルカノイル基；例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロピルオキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基等の低級アルコキシカルボニル基；例えばベンジルオキシカルボニル基、p-ニトロベンジルオキシカルボニル基、フェネチルオキシカルボニル基等のアラルキルオキシカルボニル基；例えばトリメチルシリル基、tert-ブチルジメチルシリル基等の低級アルキルシリル基等が挙げられ、特にアセチル基、ピバロイル基、ベンゾイル基、エトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基等が好ましい。

「水酸基の保護基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等の低級アルキル基；例えばトリメチルシリル基、tert-ブチルジメチルシリル基等の低級アルキルシリル基；例えばメトキシメチル基、2-メトキシエトキシメチル基等の低級アルコキシメチル基；例えばテトラヒドロピラニル基；例えばトリメチルシリルエトキシメチル基；例えばベンジル基、p-メトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、o-

ニトロベンジル基、p-ニトロベンジル基、トリチル基等のアラルキル基；例えばホルミル基、アセチル基等のアシル基等が挙げられ、特にメチル基、メトキシメチル基、テトラヒドロピラニル基、トリチル基、トリメチルシリルエトキシメチル基、*tert*-ブチルジメチルシリル基、アセチル基等が好ましい。

- 5 「カルボキシル基の保護基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、*tert*-ブチル基等の低級アルキル基；例えば2, 2, 2-トリクロロエチル基等の低級ハロアルキル基；例えば2-プロペニル基等の低級アルケニル基；例えばベンジル基、p-メトキシベンジル基、p-ニトロベンジル基、ベンズヒドリル基、トリチル基等のアラルキル基等が挙げられ、特にメチル基、エチル基、*tert*-ブチル基、2-プロペニル基、ベンジル基、p-メトキシベンジル基、ベンズヒドリル基等が好ましい。

「オキソ基又はカルボニル基の保護基」としては、エチレンケタール、トリメチレンケタール、ジメチルケタール等のアセタール、ケタール等が挙げられる。

- 一般式(I I)で表される化合物と一般式(I I I)で表される化合物との反応は、通常、化合物(I I)の1モルに対して、化合物(I I I)を等モルないし過剰モル、好ましくは等モルないし1.5モル用いて行われる。

- 反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えば水、塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、アセトン、エチルメチルケトン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等又はその混合溶媒等が好適である。

また、上記反応は塩基の存在下に行なうことが好ましく、当該塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基又は炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基を使用することができる。

- 反応溶媒として、例えばテトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等を用いた場合は、塩基として水素化ナトリウム、水素化カリウム、ナトリウム*tert*-ブトキシド、カリウム*tert*-ブトキシド等の塩基を使用することができる。

当該塩基の使用量は、通常、一般式(I I)で表される化合物1モルに対して、

等モルないし過剰モル、好ましくは1ないし5モルである。

また、上記反応は無機ハロゲン化物の存在下に行うことができ、当該無機ハロゲン化物としては、例えば臭化リチウム、ヨウ化リチウム、臭化ナトリウム、ヨウ化ナトリウム、臭化カリウム、ヨウ化カリウム等が好適である。

- 5 当該無機ハロゲン化物の使用量は、通常、一般式（I I）で表される化合物1モルに対して、0.05モルないし過剰モル、好ましくは0.2ないし5モルである。

反応温度は、通常、0℃ないし150℃、好ましくは20℃ないし100℃である。

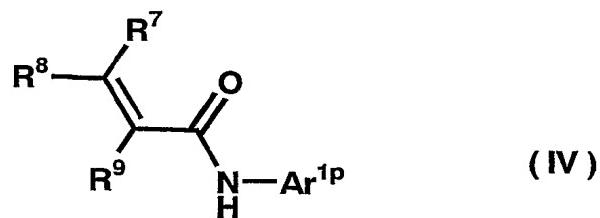
- 10 反応時間は、通常、10分間ないし7日間、好ましくは30分間ないし24時間である。

反応終了後、通常の処理を行い、一般式（I'）で表される化合物の粗生成物を得ることができる。このようにして得られた一般式（I'）で表される化合物を、常法に従って精製し、又は精製することなく、必要に応じて、アミノ基、水酸基、カルボキシル基、オキソ基及びカルボニル基の保護基の除去反応を適宜組み合わせて行うことにより、一般式（I）の化合物を製造することができる。

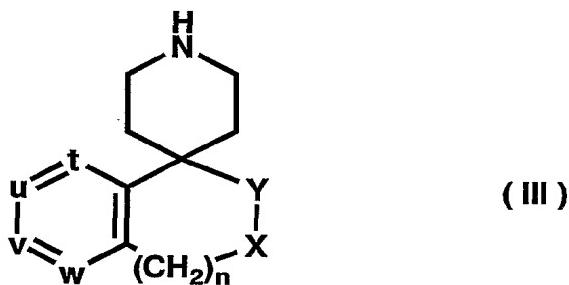
- 保護基の除去法は、当該保護基の種類及び目的化合物（I）の安定性等により異なるが、例えば文献記載の方法〔プロテクティブ・グループ・イン・オーガニック・シンセシス（Protective Groups in Organic Synthesis）、T. W. グリーン（T. W. Greene）著、John Wiley & Sons社（1981年）参照〕又はそれに準じる方法に従って、例えば酸又は塩基を用いる加溶媒分解、すなわち、例えば0.01モルないし大過剰の酸、好ましくはトリフルオロ酢酸、ギ酸、塩酸等、又は等モルないし大過剰の塩基、好ましくは水酸化カリウム、水酸化カルシウム等を作用させる方法；水素化金属錯体等を用いる化学的還元又はパラジウム－炭素触媒、ラネーニッケル触媒等を用いる接触還元等により行われる。

製造法2

一般式（I V）

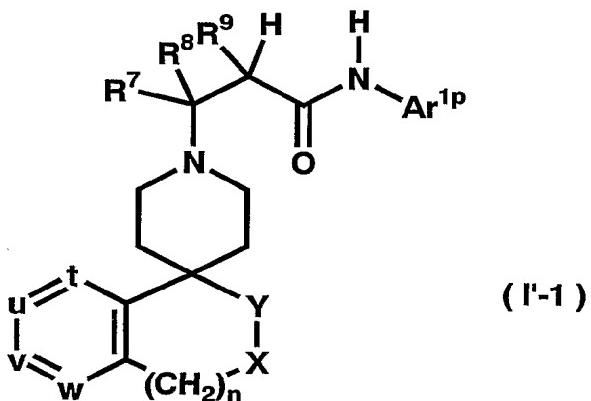


[式中、R⁷、R⁸及びR⁹は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基又はアラルキル基を意味し、Ar^{1p}は前記の意味を有する]で表される化合物と、一般式 (III)

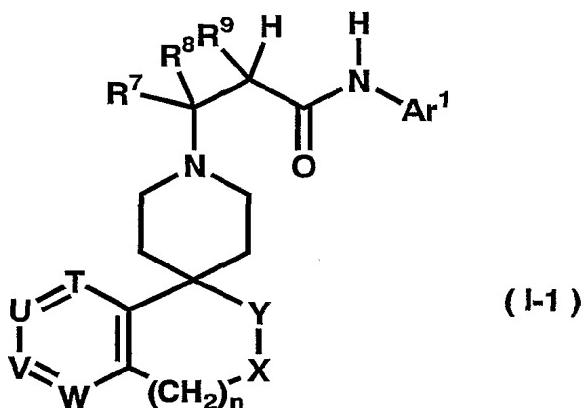


5

[式中、n、t、u、v、w、X及びYは前記の意味を有する]で表される化合物とを反応させ、一般式 (I'-1)



10 [式中、Ar^{1p}、n、R⁷、R⁸、R⁹、t、u、v、w、X及びYは前記の意味を有する]で表される化合物とし、所望により保護基を除去することにより、一般式 (I-1)



[式中、 Ar^1 、 n 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 T 、 U 、 V 、 W 、 X 及び Y は前記の意味を有する]で表される化合物を製造することができる。

本製造法は、一般式(I)で表される化合物のうち、式中のAが、低級アルキル基又はアラルキル基で置換されていてもよいエチレン基である化合物、すなわち、一般式(I-1)で表される化合物の製造法である。

一般式(IV)で表される化合物と一般式(III)で表される化合物との反応は、通常、化合物(IV)の1モルに対して、化合物(III)を等モルないし過剰モル、好ましくは等モルないし1.5モル用いて行われる。

反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等又はその混合溶媒等が好適である。

また、上記反応は塩基の非存在下でも進行するが、より円滑に反応を進行させるため塩基の存在下に行うことが好ましい。

当該塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基又は炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基を使用することができる。

当該塩基の使用量は、通常、一般式(III)で表される化合物1モルに対して、等モルないし過剰モル、好ましくは1ないし5モルである。

反応温度は、通常、0℃ないし150℃、好ましくは20℃ないし100℃である。

反応時間は、通常、10分間ないし7日間、好ましくは30分間ないし24時

間である。

反応終了後、生成物に保護基が存在する場合、当該保護基を除去した後に、又は生成物に保護基が存在しない場合はそのまま通常の処理を行い、一般式（I – 1）の化合物を製造することができる。

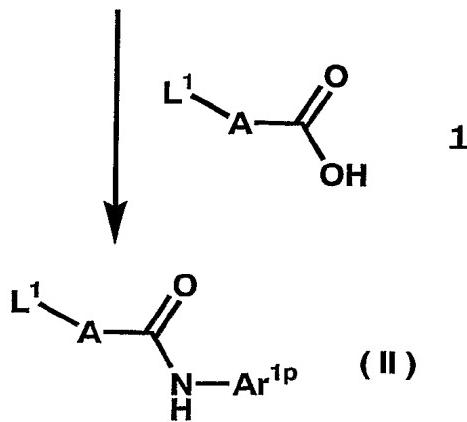
5 保護基の除去及び後処理等は、前記製造法1に記載した方法に準じて行うことができる。

一般式（I）又は（I – 1）の化合物は、通常の分離手段により容易に単離精製できる。かかる手段としては、例えば溶媒抽出、再結晶、カラムクロマトグラフィー、分取薄層クロマトグラフィー等を例示できる。

10 これらの化合物は、常法により医薬として許容されうる塩又はエステルと/or ことができ、また逆に塩又はエステルから遊離化合物への変換も常法に従って行うことができる。

一般式（I I）、（I I I）又は（I V）で表される化合物は、例えば市販品を用いるか、文献記載の方法〔テトラヘドロン（Tetrahedron）、5
15 3巻、10983頁（1997年）；WO 00/27845号；WO 01/14
376号等参照〕若しくはこれらの方に準じる方法、あるいは以下の方法又は実施例に記載する方法等を必要に応じ適宜組み合わせることにより製造することができる。

製造法A



本製造法は一般式（II）で表される化合物の製造法である。

一般式（V）で表される化合物と一般式1で表されるカルボン酸との反応は、通常、一般式（V）で表される化合物1モルに対して、一般式1で表されるカルボン酸を0.5モルないし過剰モル、好ましくは1モルないし1.5モル用いて

5 行われる。

反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ピリジン等又はその混合溶媒等が好適である。

また、上記反応は縮合剤の存在下に行なうことが好ましく、当該縮合剤としては、

10 例えはN, N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド、N, N' -ジイソプロピルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩、ベンゾトリアゾール-1-イルオキシートリス-(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ベンゾトリアゾール-1-イルオキシートリス-15 ピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、プロモトリス-(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ジフェニルりん酸アジド、1, 1'-カルボニルジイミダゾール等を使用することができる。

当該縮合剤は、通常、一般式1で表される化合物1モルに対して、1モルないし過剰モル、好ましくは1モルないし1.5モルを用いることができる。

20 反応温度は、通常、-50℃ないし100℃、好ましくは-20℃ないし50℃である。

反応時間は、通常、30分間ないし7日間、好ましくは1時間ないし24時間である。

一般式1で表されるカルボン酸に代えて、該カルボン酸の反応性誘導体と一般25 式（V）で表される化合物とを反応させることにより、一般式（II）で表される化合物を製造することもできる。

一般式1で表されるカルボン酸の反応性誘導体としては、例えは酸ハロゲン化物、混合酸無水物、活性エステル、活性アミド等が用いられる。

一般式1のカルボン酸の酸ハロゲン化物は、一般式1のカルボン酸を常法に従

ってハロゲン化剤と反応させることにより得ることができる。ハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、三塩化りん、五塩化りん、オキシ塩化りん、三臭化りん、オキサリルクロリド、ホスゲン等が用いられる。

一般式1のカルボン酸の混合酸無水物は、一般式1のカルボン酸を常法に従つ
5 て、例えばクロロ炭酸エチル等のクロロ炭酸アルキル；ピバロイルクロリド等の
脂肪族カルボン酸クロリド等と反応させることにより得ることができる。

一般式1のカルボン酸の活性エステルは、一般式1のカルボン酸を常法に従つ
て、例えばN, N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルア
ミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド等の縮合剤の存在下、例えはN-ヒ
10 ドロキシスクシンイミド、N-ヒドロキシフタルイミド、1-ヒドロキシベンゾ
トリゾール等のN-ヒドロキシ化合物；4-ニトロフェノール、2, 4-ジニ
トロフェノール、2, 4, 5-トリクロロフェノール、ペンタクロロフェノール
等のフェノール化合物等と反応させることにより得ることができる。

一般式1のカルボン酸の活性アミドは、一般式1のカルボン酸を常法に従つて、
15 例えは1, 1'-カルボニルジイミダゾール、1, 1'-カルボニルビス(2-
メチルイミダゾール)等と反応させることにより得ることができる。

一般式(V)で表される化合物と一般式1で表されるカルボン酸の反応性誘導
体との反応は、通常、一般式(V)で表される化合物1モルに対して、一般式1
で表されるカルボン酸の反応性誘導体を0. 5モルないし過剰モル、好ましくは
20 1モルないし1. 5モル用いて行われる。

反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えは塩化
メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ピリジ
ン等又はその混合溶媒等が好適である。

また、上記反応は塩基の非存在下でも進行するが、より円滑に反応を進行させ
25 るため塩基の存在下に行なうことが好ましい。

当該塩基としては、例えはトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、
ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基又は水酸化ナトリウム、水
酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩
基を使用することができる。

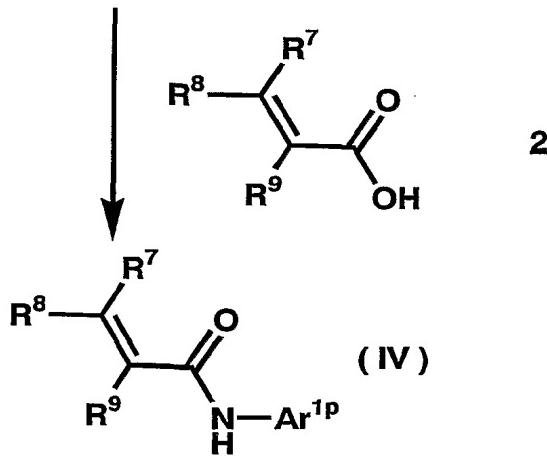
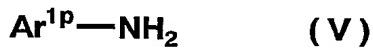
当該塩基は、通常、一般式（V）で表される化合物1モルに対して、1モルないし過剰モル用いるのが好適である。また当該塩基が液体である場合には、当該塩基を溶媒兼塩基として用いることができる。

反応温度は、通常、-50°Cないし100°C、好ましくは-20°Cないし50°Cである。

反応時間は、通常、5分間ないし7日間、好ましくは30分間ないし24時間である。

なお、一般式（V）又は1で表される化合物は市販品を用いるか、公知の方法又はそれらに準じる方法を必要に応じ適宜組み合わせることにより製造することができる。

製造法B



[式中、Ar^{1p}、R⁷、R⁸及びR⁹は前記の意味を有する]

本製造法は一般式（IV）で表される化合物の製造法である。

一般式（V）で表される化合物と一般式2で表されるカルボン酸との反応は、通常、一般式（V）で表される化合物1モルに対して、一般式2で表されるカルボン酸を0.5モルないし過剰モル、好ましくは1モルないし1.5モル用いて行われる。

反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ピリジン等又はその混合溶媒等が好適である。

また、上記反応は縮合剤の存在下に行なうことが好ましく、当該縮合剤としては、例えばN, N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド、N, N' -ジイソプロピルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩、
5 ベンゾトリアゾール-1-イルオキシートリス-(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ベンゾトリアゾール-1-イルオキシートリス-ピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、プロモトリス-(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ジフェニルりん酸アジド、1, 1'-カルボニルジイミダゾール等を使用することができる。

10 当該縮合剤は、通常、一般式2で表される化合物1モルに対して、1モルないし過剰モル、好ましくは1モルないし1.5モルを用いることができる。

反応温度は、通常、-50℃ないし100℃、好ましくは-20℃ないし50℃である。

15 反応時間は、通常、30分間ないし7日間、好ましくは1時間ないし24時間である。

一般式2で表されるカルボン酸に代えて、該カルボン酸の反応性誘導体と一般式(V)で表される化合物とを反応させることにより、一般式(IV)で表される化合物を製造することもできる。

一般式2で表されるカルボン酸の反応性誘導体としては、例えば酸ハロゲン化物、混合酸無水物、活性エステル、活性アミド等が用いられる。

一般式2のカルボン酸の酸ハロゲン化物は、一般式2のカルボン酸を常法に従ってハロゲン化剤と反応させることにより得ることができる。ハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、三塩化りん、五塩化りん、オキシ塩化りん、三臭化りん、オキサリルクロリド、ホスゲン等が用いられる。

25 一般式2のカルボン酸の混合酸無水物は、一般式2のカルボン酸を常法に従つて、例えばクロロ炭酸エチル等のクロロ炭酸アルキル；ピバロイルクロリド等の脂肪族カルボン酸クロリド等と反応させることにより得ることができる。

一般式2のカルボン酸の活性エステルは、一般式2のカルボン酸を常法に従つて、例えばN, N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルア

ミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド等の縮合剤の存在下、例えば N - ヒドロキシスクシンイミド、N - ヒドロキシフタルイミド、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール等の N - ヒドロキシ化合物；4 - ニトロフェノール、2, 4 - ジニトロフェノール、2, 4, 5 - トリクロロフェノール、ペンタクロロフェノール等のフェノール化合物等と反応させることにより得ることができる。

一般式2のカルボン酸の活性アミドは、一般式2のカルボン酸を常法に従って、例えば 1, 1' - カルボニルジイミダゾール、1, 1' - カルボニルビス(2 - メチルイミダゾール) 等と反応させることにより得ができる。

一般式2で表される化合物と一般式2で表されるカルボン酸の反応性誘導体との反応は、通常、一般式(V)で表される化合物 1 モルに対して、一般式2で表されるカルボン酸の反応性誘導体を 0.5 モルないし過剰モル、好ましくは 1 モルないし 1.5 モル用いて行われる。

反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ピリジン等又はその混合溶媒等が好適である。

また、上記反応は塩基の非存在下でも進行するが、より円滑に反応を進行させるため塩基の存在下に行なうことが好ましい。

当該塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4 - ジメチルアミノピリジン等の有機塩基又は水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基を使用することができる。

当該塩基は、通常、一般式(V)で表される化合物 1 モルに対して、1 モルないし過剰モル用いるのが好適である。また当該塩基が液体である場合には、当該塩基を溶媒兼塩基として用いることができる。

反応温度は、通常、-50℃ないし 100℃、好ましくは-20℃ないし 50℃である。

反応時間は、通常、5 分間ないし 7 日間、好ましくは 30 分間ないし 24 時間である。

なお、一般式2で表される化合物は市販品を用いるか、公知の方法又はそれら

に準じる方法を必要に応じ適宜組み合わせることにより製造することができる。

本発明の化合物の医薬としての有用性は、例えば下記の薬理試験例においてN P Y拮抗活性を示すことにより証明される。

薬理試験例 1 (N P Y結合阻害試験)

5 ヒトN P Y Y 5受容体をコードするc DNA配列〔国際特許出願WO 9 6 /
1 6 5 4 2号明細書参照〕を、発現ベクターp c DNA 3、p R c / R S V (イ
ンビトロジエン社製) 及びp C I - n e o (プロメガ社製) にクローニングした。
得られた発現ベクターをカチオン性脂質法〔Proceedings of the national a
cademy of sciences of the united states of America)、84巻、7413頁(1987年) 参照〕を
用いて宿主細胞COS-7、CHO及びLM (tk-) (アメリカン・タイプ・
カルチャー・コレクション) にトランスフェクトし、N P Y Y 5受容体発現細
10胞を得た。

N P Y Y 5受容体を発現させた細胞から調製した膜標品を被検化合物及び2
0, 0 0 0 c pmの [¹²⁵I]ペプタイドYY (NEN社製) とともに、アッセイ緩衝液 (10 mM 塩化マグネシウム、1 mM フェニルメチルスルホニルフ
ルオリド、0. 1%バシトラシン及び0. 5%ウシ血清アルブミンを含む25 m
20 M Tris 緩衝液、pH 7. 4) 中で25°C、2時間インキュベーションした
後、グラスフィルターGF/Cにて濾過した。0. 3%BSAを含む5 mM T
ris 緩衝液、pH 7. 4にて洗浄後、グラスフィルター上の放射活性を求めた。
非特異的結合は1 μM ペプタイドYY存在下で測定し、特異的ペプタイドYY
結合に対する被検化合物の50%阻害濃度 (IC₅₀値) を求めた [Endocrinology、131巻、2090頁(1992年)
25 参照]。その結果を表9に示す。

表9 NPY受容体結合阻害作用

| 化合物 | IC ₅₀ 値(nM) |
|--------|------------------------|
| 実施例 1 | 3.2 |
| 実施例 4 | 10 |
| 実施例 29 | 2.4 |

上記に示すとおり、本発明の化合物はNPY-Y5受容体に対するペプタイドYY(NPYと同族物質)の結合を強力に阻害した。

薬理試験例2 (bPPにより誘発される摂食行動に対する拮抗試験)

5 ペントバルビタール麻酔下(50mg/kg腹腔内単回投与)、雄性SDラット(7-8週令、200-300g)の右側脳室に脳定位固定的に慢性ガイドカニューレ(外径0.8mm、内径0.5mm、長さ10mm)を挿入、歯科用レジンで固定した。ガイドカニューレの先端の位置はbregmaより後方0.9mm、正中線より右に1.2mm、脳表面より深さ1.5mmとし、内針を挿入
10 した際にその先端約2mmがガイドカニューレの先端から出て、側脳室に達するようにした。約1週間の回復期間の後、ウシパンクレアチックポリペプタイド(bPP、5μg/10μL/head、0.05%ウシ血清アルブミンを含む0.01M、pH7.4リン酸緩衝生理食塩水)を側脳室内に投与した。被検化合物はbPP投与の2時間前に0.5%メチルセルロース水溶液に懸濁して経口投与
15 し、bPP投与後2時間の摂餌量を測定した。

本発明の化合物は側脳室内に投与したbPP(NPYと同族物質)による摂食量の増加を有意に抑制した。

一般式(I)で表される化合物は、経口又は非経口的に投与することができ、そしてそのような投与に適する形態に製剤化することにより、NPYが関与する各種の疾患、すなわち、例えば高血圧、腎臓病、心疾患、血管れん縮、動脈硬化症等の循環器系疾患、例えば過食症、うつ病、不安、痙攣、てんかん、痴呆、痛み、アルコール依存症、薬物の断薬に伴う禁断症状、概日リズムの変調、精神分

裂病（統合失調症）等の中枢性疾患、例えば肥満症、糖尿病、ホルモン異常、高コレステロール血症、高脂血症等の代謝性疾患、性及び生殖機能障害、例えば消化管運動障害等の消化器系疾患、呼吸器系疾患、炎症又は線内障等、より好ましくは過食症、肥満症、糖尿病等の処置剤として供することができる。本発明の化合物を臨床的に用いるにあたり、その投与形態に合わせ、薬剤学的に許容される添加剤を加えて各種製剤化の後投与することも可能である。その際の添加剤としては、製剤分野において通常用いられる各種の添加剤が使用可能であり、例えばゼラチン、乳糖、白糖、酸化チタン、デンプン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、トウモロコシデンプン、マイクロクリスタリンワックス、白色ワセリン、メタケイ酸アルミニン酸マグネシウム、無水リン酸カルシウム、クエン酸、クエン酸三ナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ソルビトール、ソルビタン脂肪酸エステル、ポリソルベート、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン、硬化ヒマシ油、ポリビニルピロリドン、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、タルク、植物油、ベンジルアルコール、アラビアゴム、プロピレングリコール、ポリアルキレングリコール、シクロデキストリン又はヒドロキシプロピルシクロデキストリン等が挙げられる。

これらの添加剤との混合物として製剤化される剤形としては、例えば錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤若しくは坐剤等の固形製剤；又は例えばシロップ剤、エリキシル剤若しくは注射剤等の液体製剤等が挙げられ、これらは、製剤分野における通常の方法に従って調製することができる。なお、液体製剤にあっては、用時に水又は他の適当な媒体に溶解又は懸濁させる形であってもよい。また、特に注射剤の場合、必要に応じて生理食塩水又はブドウ糖液に溶解又は懸濁させてもよく、更に緩衝剤や保存剤を添加してもよい。

これらの製剤は、本発明の化合物を全薬剤 1.0～100重量%、好ましくは 1.0～60重量%の割合で含有することができる。これらの製剤は、また、治療上有効な他の化合物を含んでいてもよい。

本発明化合物は代謝障害及び／又は摂食障害の処置に有用な他剤と組み合わせて使用することができる。そのような組み合わせの個々の成分は、処置期間中、別々の異なる時に又は同時に、分割された又は单一の製剤で投与することができ

る。したがって、本発明は同時の又は時間が異なる投与の全てを含むと解釈すべきであり、本発明における投与はそのように解釈すべきである。本発明化合物と代謝障害及び／又は摂食障害の処置に有用な他剤との組み合わせの範囲には、原則として代謝障害及び／又は摂食障害の処置に有用ないかなる医薬製剤との組み合わせも含まれる。

本発明の化合物を例えば臨床の場で使用する場合、その投与量及び投与回数は、患者の性別、年齢、体重、症状の程度及び目的とする処置効果の種類と範囲等により異なるが、一般に経口投与の場合、成人1日あたり、0.01～100mg/kg、好ましくは0.03～3mg/kgを1～数回に分けて、また非経口投与の場合は、0.001～10mg/kg、好ましくは0.001～0.1mg/kgを1～数回に分けて投与するのが好ましい。

通常の内科医、獣医又は臨床医は病状進行を阻止し、抑制し又は停止させるに必要な効果的薬物量を容易に決定し処理することができる。

15 発明を実施するための最良の形態

実施例を挙げて本発明を更に具体的に説明するが、本発明はこれらによって何ら限定されるものではない。

なお、融点はMP-S3モデル（柳本製作所製）を用いて測定し、補正を加えず記した。

20 実施例1

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド塩酸塩の製造

(1) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-クロロアセトアミドの製造

4-アミノベンゾフェノン(197mg)及びトリエチルアミン(279μl)
25) のクロロホルム(2ml)溶液に、氷冷下クロロアセチルクロリド(159μl)を滴下した。10分間攪拌後、反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、酢酸エチルより結晶化し表題化合物(241mg)を得た。

(2) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミドの製造

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-クロロアセトアミド(137mg)及び1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]塩酸塩(151mg)のアセトン(2ml)の懸濁液に炭酸カリウム(140mg)を加え15時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=1/1)にて精製し、表題化合物を得た。

(3) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド塩酸塩の製造

上記、N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミドを4N塩酸-酢酸エチル溶液で処理した。生じた結晶を濾取し、表題化合物(212mg)を得た。

融点 178-180°C

実施例1-(2)で用いたN-(4-ベンゾイルフェニル)-2-クロロアセトアミドを、それぞれ所望の化合物に対応する原料に替え、他は実施例1-(2)と同様にして実施例2~22の化合物を得た。

実施例2

N-(2-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

融点 204-205°C

実施例3

N-(3-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

融点 112 - 115 °C

実施例 4

5 N - (4 - ビフェニリル) - 2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン
- 3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] アセトアミド

融点 239 - 240 °C

実施例 5

10 N - (5 - ベンゾイル - 2 - ピリジル) - 2 - [1 - メチルスルホニルスピロ
[インドリン - 3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] アセトアミド

融点 175 - 177 °C

実施例 6

15 N - (3 - クロロフェニル) - 2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリ
ン - 3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] アセトアミド

融点 191 - 193 °C

実施例 7

20 N - (4 - クロロフェニル) - 2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリ
ン - 3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] アセトアミド

融点 181 - 182 °C

実施例 8

25 2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ピペリジン] -
1' - イル] - N - (5 - フェニル - 2 - チアゾリル) アセトアミド

融点 234 - 238 °C

実施例 9

2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ピペリジン] -

1' -イル] -N-(5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)
アセトアミド

融点 239-242°C

5 実施例 10

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] -N-(5-フェニル-2-ピラジニル)アセトアミド

融点 257-259°C

10 実施例 11

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] -N-(4-フェニル-2-チアゾリル)アセトアミド

融点 103-106°C

15 実施例 12

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] -N-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)アセトアミド

融点 207-209°C

20 実施例 13

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] -N-(2-フェニル-4-ピリミジニル)アセトアミド

融点 176-178°C

25 実施例 14

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] -N-(4-フェニル-2-ピリミジニル)アセトアミド

融点 195-198°C

実施例 15

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] -N-(1-フェニル-4-イミダゾリル)アセトアミド

融点 208-221°C

5

実施例 16

N-(6-メトキシ-7-アザベンゾチアゾール-2-イル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

10 融点 285-288°C

実施例 17

N-(2-ベンゾチアゾリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

15 融点 218-219°C

実施例 18

N-(6-メチル-2-キノリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

20 融点 132-136°C

実施例 19

N-(4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

25 融点 162-165°C

実施例 20

N-(6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

融点 268 - 270 °C

実施例 2 1

2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' - ピペリジン] -

5 1' - イル] - N - (1 - ナフチル) アセトアミド

融点 185 - 186 °C

実施例 2 2

N - (5 - クロロ - 2 - ベンゾオキサゾリル) - 2 - [1 - メチルスルホニル

10 スピロ [インドリン-3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] アセトアミド

融点 229 - 230 °C

所望の化合物に対応するスピロピペリジン及びクロロアセトアミド誘導体を用い、実施例 1 - (2) と同様にして実施例 2 3 ~ 3 0 の化合物を得た。

15

実施例 2 3

N - (4 - ベンゾイルフェニル) - 2 - [1 - エチルスルホニルスピロ [イン

ドリン-3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] アセトアミド

¹H-NMR (300 MHz, CDCl₃, δ ppm) : 1. 41 (3H, t, J = 7. 7 Hz), 1. 78 - 1. 86 (2H, m), 2. 00 - 2. 09 (2H, m), 2. 38 - 2. 98 (2H, m), 2. 92 - 2. 99 (2H, m), 3. 14 (2H, q, J = 7. 7 Hz), 3. 22 (2H, s), 3. 90 (2H, s), 7. 06 (1H, t, J = 7. 1 Hz), 7. 20 - 7. 59 (6H, m), 7. 70 - 7. 86 (6H, m), 9. 30 (1H, s).

25

実施例 2 4

N - (4 - ベンゾイルフェニル) - 2 - [1 - アセチルスピロ [インドリン-

3, 4' - ピペリジン] - 1' - イル] アセトアミド

¹H-NMR (300 MHz, CDCl₃, δ ppm) : 1. 73 - 1. 84 (

2 H, m), 1. 98 - 2. 10 (2 H, m), 2. 27 (3 H, s), 2. 3
 9 - 2. 50 (2 H, m), 2. 92 - 3. 05 (2 H, m), 3. 23 (2 H,
 s), 3. 89 (2 H, s), 7. 07 - 7. 28 (3 H, m), 7. 45 - 7.
 60 (3 H, m), 7. 70 - 7. 88 (6 H, m), 8. 23 (1 H, d, J
 5 = 7. 5 Hz), 9. 32 (1 H, s).

実施例 25

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[7-
 アザインドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

10 ¹H-NMR (300 MHz, CD₃OD, δ ppm) : 1. 86 - 1. 77 (2 H, m), 2. 18 - 2. 07 (2 H, m), 2. 50 - 2. 41 (2 H, m), 3. 00 - 2. 94 (2 H, m), 3. 27 (3 H, s), 3. 96 (2 H, b r s), 4. 91 - 4. 83 (2 H, m), 7. 06 - 7. 01 (1 H, m), 7. 57 - 7. 49 (2 H, m), 7. 66 - 7. 60 (1 H, m), 7. 81
 15 - 7. 70 (6 H, m), 8. 12 - 8. 09 (1 H, m).

実施例 26

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[2-ヒドロキシ-1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

20 融点 124 - 127°C

実施例 27

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピロ[イソキノリン-1 (2 H), 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

25 下

融点 164 - 167°C

実施例 28

2-[3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピロ[イソキノリン-1 (2 H), 4-

’-ピペリジン]-1'-イル]-N-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)
)アセトアミド

融点 230-233°C

5 実施例 29

2-[3-オキソスピロ[イソベンゾフラン-1(3H), 4'-ピペリジン]
-1'-イル]-N-(2-フェニル-4-ピリジル)アセトアミド

融点 213-214°C

10 実施例 30

2-[3-オキソスピロ[6-アザイソベンゾフラン-1(3H), 4'-ピ
ペリジン]-1'-イル]-N-(2-フェニル-4-ピリジル)アセトアミド

融点 224-225°C

15 実施例 31

2-[3-オキソスピロ[イソベンゾフラン-1(3H), 4'-ピペリジン]
-1'-イル]-N-(1-フェニル-3-ピラゾリル)アセトアミド塩酸塩
の製造

所望の化合物に対応するスピロピペリジン及びクロロアセトアミド誘導体を用
い、実施例 1 と同様にして表題化合物を得た。

融点 259-261°C

実施例 32

N-(3-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン
-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-2-フェニルアセトアミドの製造

N-(3-ビフェニリル)-2-クロロ-2-フェニルアセトアミド (104 mg) 及び 1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン] 塩酸塩 (89 mg) のアセトン (5 ml) の懸濁液に、炭酸カリウム (122 mg) を加え 15 時間加熱還流した。室温に冷却後、反応液に水を加え酢酸エチル

にて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン／酢酸エチル＝1／2）にて精製し、表題化合物（5.8mg）を得た。

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃, δ ppm) : 1. 65-1. 83 (5 2H, m), 2. 00-2. 18 (3H, m), 2. 32-2. 42 (1H, m), 2. 78-2. 81 (1H, m), 2. 87 (3H, s), 3. 10-3. 18 (1H, m), 3. 72 (1H, d, J=10. 3Hz), 3. 78 (2H, d, J=10. 3Hz), 4. 07 (1H, s), 7. 09 (2H, t, J=6. 7Hz), 7. 21-7. 88 (17H, m), 9. 21 (1H, s).

10

実施例3 3

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]プロピオニアミドの製造

実施例3 2で用いたN-(3-ビフェニリル)-2-クロロ-2-フェニルアセトアミドを、N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-クロロプロピオニアミドに替え、他は実施例3 2と同様にして表題化合物を得た。

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃, δ ppm) : 1. 37 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 81-1. 89 (2H, m), 1. 97-2. 09 (2H, m), 2. 33-2. 44 (1H, m), 2. 56-2. 67 (1H, m), 2. 81-2. 98 (2H, m), 2. 93 (3H, s), 3. 35 (1H, q, J=7. 0Hz), 3. 84 (2H, s), 7. 09-7. 13 (1H, m), 7. 22-7. 29 (2H, m), 7. 42-7. 51 (4H, m), 7. 70-7. 89 (6H, m), 9. 53 (1H, s).

25 実施例3 4

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]-N-(1-フェニル-4-イミダゾリル)プロピオニアミドの製造

N-(1-フェニル-4-イミダゾリル)-2-ブロモプロピオニアミド (3

5 mg) 及び 1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン] 塩酸塩 (3.6 mg) のアセトン 2 ml の懸濁液に、炭酸カリウム (1.32 mg) 及びヨウ化ナトリウム (3.6 mg) を加え 24 時間攪拌した。反応液に水を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン／酢酸エチル = 1/4) にて精製し、表題化合物 (2.2 mg) を得た。

融点 213-215°C

実施例 3-5

10 N-(3-ビフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] プチルアミドの製造

実施例 3-4 で用いた N-(1-フェニル-4-イミダゾリル)-2-ブロモプロピオニアミドを、N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-ブロモブチルアミドに替え、他は実施例 3-4 と同様にして表題化合物を得た。

15 $^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3 , δ ppm) : 1.08 (3H, t, $J=7.6\text{ Hz}$) , 1.88-2.05 (6H, m) , 2.32-2.57 (2H, m) , 2.91 (3H, s) , 2.91-3.05 (3H, m) , 3.81 (1H, d, $J=10.7\text{ Hz}$) , 3.85 (1H, d, $J=10.7\text{ Hz}$) ,
7.10 (1H, t, $J=7.2\text{ Hz}$) , 7.21-7.85 (12H, m) ,
20 9.02 (1H, s) .

実施例 3-6

25 N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] プロピオニアミドの製造

1) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-ブロモ-2-メチルプロピオニアミドの製造

4-アミノベンゾフェノン (9.30 mg) 及びトリエチルアミン (1.0 ml) のテトラヒドロフラン (2.0 ml) 溶液に、氷冷下ブロモイソブチリルブロミ

ド（ $760\mu l$ ）を滴下した。30分間攪拌後、反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後し表題化合物を得た。

5 (2) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]プロピオンアミドの製造

10 1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]塩酸塩（100mg）のテトラヒドロフラン（5ml）懸濁液に水素化ナトリウム（60%油状、140mg）を加え5分間攪拌後、N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-プロモ-2-メチルプロピオンアミド（114mg）のテトラヒドロフラン（1ml）溶液を加えた。1. 5時間攪拌後、反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出し有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン／酢酸エチル=1/1）にて精製し、表題化合物（74mg）を得た。

15 1H -NMR (300MHz, CDCl₃, δ ppm) : 1. 33 (6H, s), 1. 75-1. 85 (2H, m), 1. 97-2. 03 (2H, m), 2. 38 (2H, t, J=11. 5Hz), 2. 85-2. 90 (2H, m), 2. 90 (3H, s), 3. 82 (2H, s), 7. 08-7. 26 (3H, m), 20 7. 40-7. 60 (4H, m), 7. 71-7. 84 (6H, m), 9. 57 (1H, s).

実施例36で用いたN-(4-ベンゾイルフェニル)-2-プロモ-2-メチルプロピオンアミドを、それぞれ所望の化合物に対応する原料に替え、他は実施例36と同様にして実施例37~39の化合物を得た。

実施例37

N-(3-ビフェニリル)-2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]プロピオンアミド

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃, δ ppm) : 1. 35 (6H, s), 1. 86 (2H, d, J=12. 2Hz), 2. 00 (2H, d, J=12. 2Hz), 2. 38 (2H, t, J=10. 9Hz), 2. 88-2. 92 (2H, m), 2. 91 (3H, s), 3. 83 (2H, s), 7. 10 (1H, t, J=6. 8Hz), 7. 23-7. 28 (2H, m), 7. 31-7. 50 (7H, m), 7. 62 (1H, d, J=6. 8Hz), 7. 91 (1H, s), 9. 37 (1H, s).

実施例38

10 2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-3-ピリジル)プロピオニアミド

¹H-NMR (300MHz, CDCl₃, δ ppm) : 1. 38 (6H, m), 1. 82-1. 90 (2H, m), 1. 99-2. 10 (2H, m), 2. 38-2. 48 (2H, m), 2. 97 (3H, s), 2. 92-2. 97 (2H, m), 3. 88 (2H, s), 7. 10-7. 70 (9H, m), 8. 52-8. 61 (2H, m), 9. 53 (1H, s).

実施例39

20 2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ペリジン]-1'-イル]-N-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)プロピオニアミド

融点76-79°C

25 実施例40

N-(4-ベンゾイルフェニル)-3-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ペリジン]-1'-イル]プロピオニアミドの製造

1) N-(4-ベンゾイルフェニル)アクリルアミドの製造

4-アミノベンゾフェノン(1. 0g)及びピリジン(550μl)のテトラ

ヒドロフラン（1.5 ml）溶液に、氷冷下アクリロイルクロリド（460 μl）を滴下した。2時間攪拌後、反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、濃縮し表題化合物（1.05 g）を得た。

5 (2) N-(4-ベンゾイルフェニル)-3-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]プロピオンアミドの製造
N-(4-ベンゾイルフェニル)アクリルアミド（48 mg）及び1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]塩酸塩（58 mg）のクロロホルム（3 ml）の懸濁液にトリエチルアミン（220 μl）を加え80
10 °Cで4時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(メタノール/酢酸エチル=5/95)にて精製し、表題化合物（70 mg）を得た。

¹H-NMR (300 MHz, CDCl₃, δ ppm) : 1.87-1.92 (2H, m), 2.01-2.12 (2H, m), 2.23-2.33 (2H, m), 2.61 (2H, d, J=5.5 Hz), 2.82 (2H, d, J=5.5 Hz), 2.94 (3H, s), 3.12-3.20 (2H, m), 7.10-7.30 (3H, m), 7.40-7.61 (4H, m), 7.68 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.78 (2H, d, J=8.9 Hz), 7.88 (2H, d, J=8.8 Hz).

製剤例 1

実施例1の化合物20.0 g、乳糖417 g、結晶セルロース80 g及び部分アルファー化デンプン80 gをV型混合機を用いて混合した後、ステアリン酸マグネシウム3.0 gを加え混合した。混合末を常法に従い打錠し直径7.0 mm、1錠の重量150 mgの錠剤3000錠を得た。

一錠 (150 mg)あたりの含有量

実施例1の化合物5.0 mg

乳糖104.25 mg

結晶セルロース 20.0 mg

部分アルファー化デンプン 20.0 mg

ステアリン酸マグネシウム 0.75 mg

製剤例 2

5 ヒドロキシプロピルセルロース 2910 10.8 g 及びポリエチレングリコール 6000 2.1 g を精製水 172.5 g に溶解した後、二酸化チタン 2.1 g を分散し、コーティング液を調製した。別に調製した製剤例 1 の錠剤 250 錠にハイコーダーミニを用いてコーティング液をスプレーコーティングし、重量 155 mg のフィルムコート錠を得た。

10 一錠 (155 mg)あたりの含有量

製剤例 1 の錠剤 150 mg

ヒドロキシプロピルセルロース 2910 3.6 mg

ポリエチレングリコール 6000 0.7 mg

二酸化チタン 0.7 mg

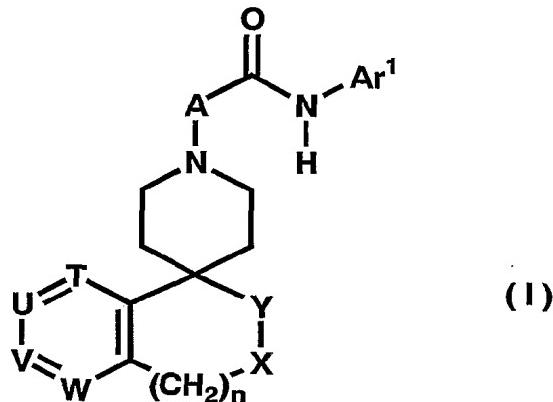
15

産業上の利用可能性

本発明の化合物は、NPY拮抗作用を有するため、NPYが関与する各種の疾患、すなわち、例えば高血圧、腎臓病、心疾患、血管れん縮、動脈硬化症等の循環器系疾患、例えば過食症、うつ病、不安、痙攣、てんかん、痴呆、痛み、アルコール依存症、薬物の断薬に伴う禁断症状、概日リズムの変調、精神分裂病（統合失調症）等の中権性疾患、例えば肥満症、糖尿病、ホルモン異常、高コレステロール血症、高脂血症等の代謝性疾患、性及び生殖機能障害、例えば消化管運動障害等の消化器系疾患、呼吸器系疾患、炎症又は線内障等の処置剤として有用である。

請 求 の 範 囲

(1) 一般式 (I)

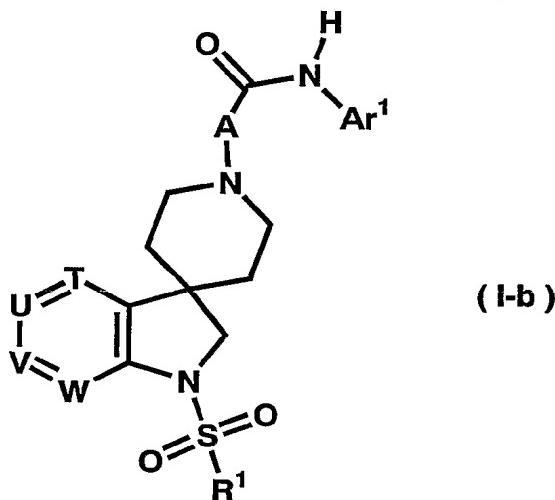


- 5 [式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、
- 10 低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；nは0又は1を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R¹は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R²及びR⁵は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R³及びR⁴は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい

メチル基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチル基を意味し；Xは $-N(SO_2R^1)$ ー、 $-N(COR^2)$ ー又は $-CO-$ で表される基を意味し；Yは $-C(R^3)(R^4)$ ー、 $-O-$ 又は $-N(R^5)$ ーで表される基を意味する]で表される化合物、その塩又はエステル。

- 5 (2) Xが $-N(SO_2R^1)$ ー若しくは $-N(COR^2)$ ーで表される基であり、nが0であり、かつYが $-C(R^3)(R^4)$ ーで表される基であるか、又はXが $-CO-$ で表される基であり、かつYが $-O-$ 若しくは $-N(R^5)$ ーで表される基である請求項1記載の化合物。

(3) 一般式 (I-b)



10

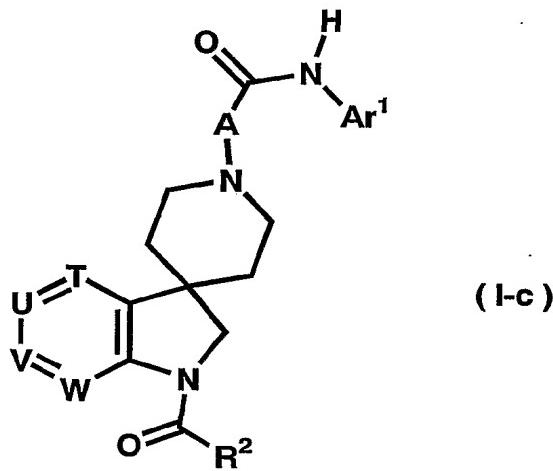
- [式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有してい

てもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R¹は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；

T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有してもよいメ

5 チン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチル基を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

(4) 一般式 (I-c)



[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択

10 される置換基を有してもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で

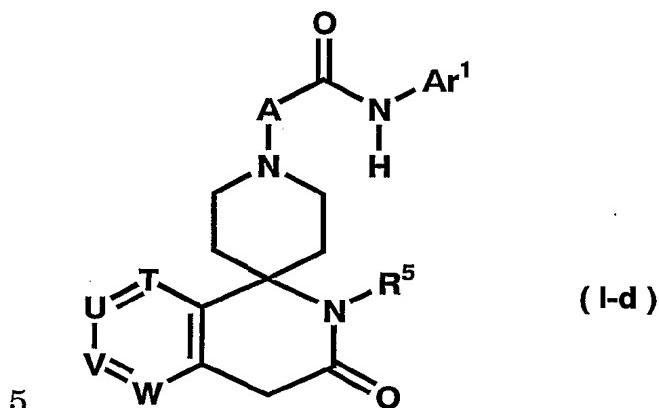
15 表される基からなる群より選択される置換基を有してもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、

低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有してもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニ

20 ル基を意味し；R²は水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキ

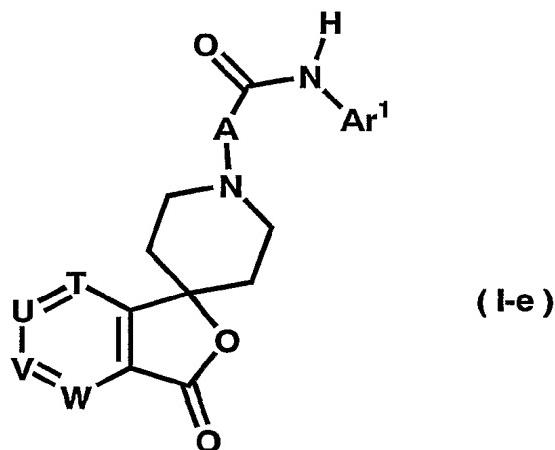
ル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有してもよいメチル基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチル基を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

(5) 一般式 (I-d)



[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有してもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有してもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有してもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R⁵は水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有してもよいメチル基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチル基を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

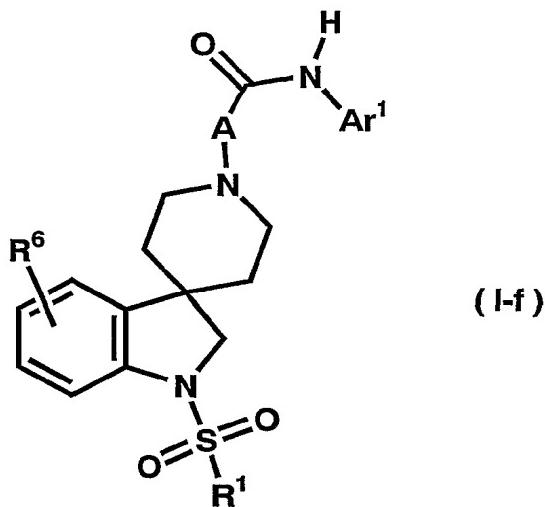
(6) 一般式 (I-e)



[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

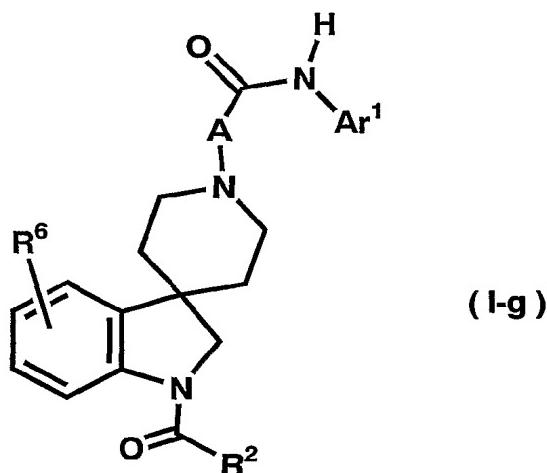
(7) T、U、V及びWのいずれか1つが窒素原子である請求項1、2、3、4、5又は6記載の化合物。

20 (8) 一般式 (I-f)



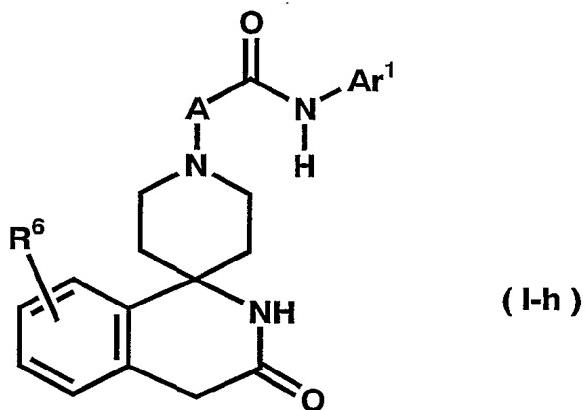
[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R¹は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R⁶は水素原子又はハロゲン原子を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

(9) 一般式 (I-g)



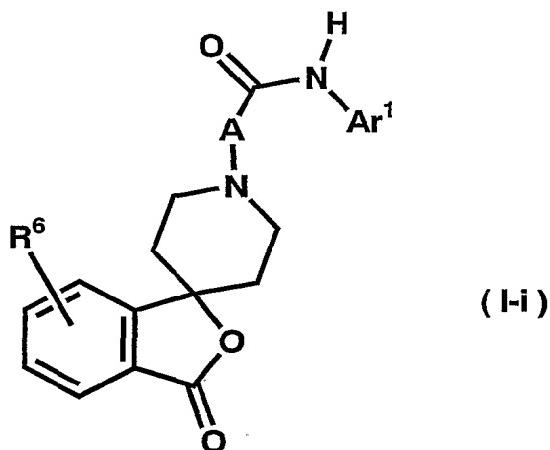
[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R²は水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R⁶は水素原子又はハロゲン原子を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

(10) 一般式 (I-h)



[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R⁶は水素原子又はハロゲン原子を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

(11) 一般式 (I-i)



[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R⁶は水素原子又はハロゲン原子を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

- (12) Ar¹がハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよいアリール基である請求項1、2、3、4、5、6、7、8、9、10又は11記載の化合物。
- (13) Ar¹がハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低

級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよいヘテロアリール基である請求項1、2、3、4、5、6、7、8、9、10又は11記載の化合物。

(14) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

N-(2-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

N-(3-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

N-(4-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

N-(5-ベンゾイル-2-ピリジル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

N-(3-クロロフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

N-(4-クロロフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-2-チアゾリル)アセトアミド、

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)アセトアミド、

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(4-フェニル-2-チアゾリル)アセトアミド、

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-2-ピラジニル)アセトアミド、

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(4-フェニル-2-チアゾリル)アセトアミド、

2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] -
1' -イル] -N- (3-フェニル-5-イソオキサゾリル) アセトアミド、
2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] -
1' -イル] -N- (2-フェニル-4-ピリミジニル) アセトアミド、
5 2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] -
1' -イル] -N- (4-フェニル-2-ピリミジニル) アセトアミド、
2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] -
1' -イル] -N- (1-フェニル-4-イミダゾリル) アセトアミド、
N- (6-メトキシ-7-アザベンゾチアゾール-2-イル) -2 - [1-メ
10 チルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] -1' -イル] アセトアミド、
N- (2-ベンゾチアゾリル) -2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インド
リニ-3, 4' -ピペリジン] -1' -イル] アセトアミド、
N- (6-メチル-2-キノリル) -2 - [1-メチルスルホニルスピロ [イ
15 ンドリン-3, 4' -ピペリジン] -1' -イル] アセトアミド、
N- (4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル) -2 - [1-メチルスルホニルス
ピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] -1' -イル] アセトアミド、
N- (6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル) -2 - [1-メチルスルホニルス
ピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] -1' -イル] アセトアミド、
20 2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] -
1' -イル] -N- (1-ナフチル) アセトアミド、
N- (5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル) -2 - [1-メチルスルホニル
スピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] -1' -イル] アセトアミド、
N- (4-ベンゾイルフェニル) -2 - [1-エチルスルホニルスピロ [イン
25 ドリン-3, 4' -ピペリジン] -1' -イル] アセトアミド、
N- (4-ベンゾイルフェニル) -2 - [1-アセチルスピロ [インドリン-
3, 4' -ピペリジン] -1' -イル] アセトアミド、
N- (4-ベンゾイルフェニル) -2 - [1-メチルスルホニルスピロ [7-
アザインドリン-3, 4' -ピペリジン] -1' -イル] アセトアミド、

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[2-ヒドロキシ-1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピロ[イソキノリン-1(2H), 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
5

2-[3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピロ[イソキノリン-1(2H), 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)アセトアミド、

2-[3-オキソスピロ[イソベンゾフラン-1(3H), 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(2-フェニル-4-ピリジル)アセトアミド、
10

2-[3-オキソスピロ[6-アザイソベンゾフラン-1(3H), 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(2-フェニル-4-ピリジル)アセトアミド、

2-[3-オキソスピロ[イソベンゾフラン-1(3H), 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(1-フェニル-3-ピラゾリル)アセトアミド、

15 N-(3-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-2-フェニルアセトアミド、

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]プロピオンアミド、

20 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(1-フェニル-4-イミダゾリル)プロピオンアミド、

N-(3-ビフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]ブチルアミド、

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]プロピオンアミド、

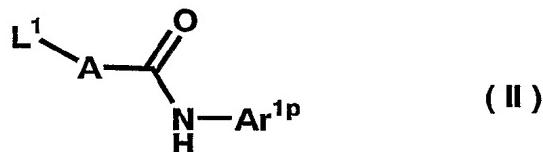
25 N-(3-ビフェニリル)-2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]プロピオンアミド、

2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-3-ピリジル)プロピオンアミド、

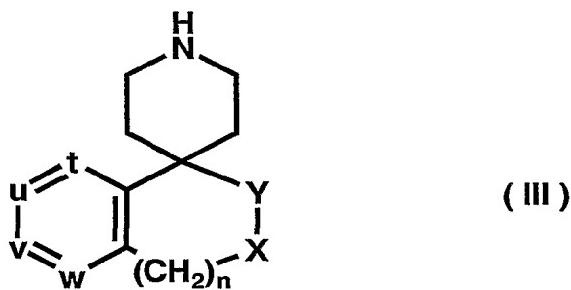
2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)プロピオンアミド又は

5 N-(4-ベンゾイルフェニル)-3-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]プロピオンアミドである請求項1記載の化合物。

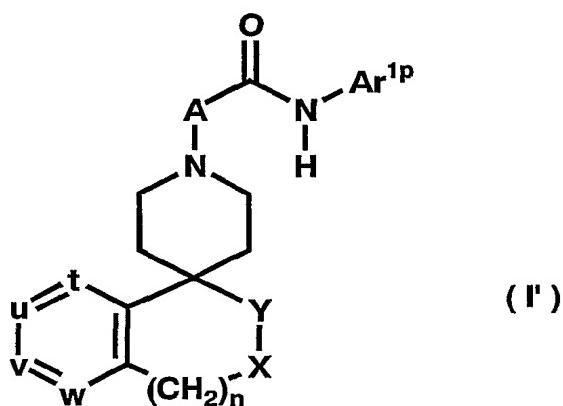
(15) 一般式 (II)



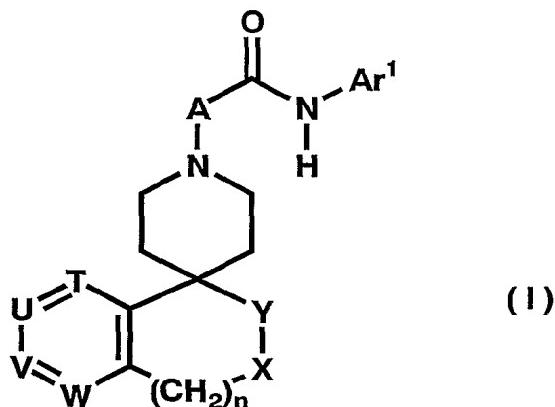
[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar^{1p}はハロゲン原子、ニトロ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q^p-Ar^{2p}で表される基並びに保護されていてもよい、オキソ基、ヒドロキシ低級アルキル基及びカルボキシル基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar^{2p}はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基並びに保護されていてもよい、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基及び低級アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；L¹は脱離基を意味し；Q^pは単結合又は保護されていてもよいカルボニル基を意味する]で表される化合物と、一般式 (III)]



[式中、nは0又は1を意味し；R¹は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R²及びR⁵は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R³及びR⁴は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；t、u、v及びwは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基及び低級アルコキシ基並びに保護されていてもよい水酸基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチル基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチル基を意味し；Xは-N(SO₂R¹)₂、-N(COR²)₂又は-CO-で表される基を意味し；Yは-C(R³)(R⁴)₂、-O-又は-N(R⁵)₂で表される基を意味する]で表される化合物とを反応させ、一般式(I')

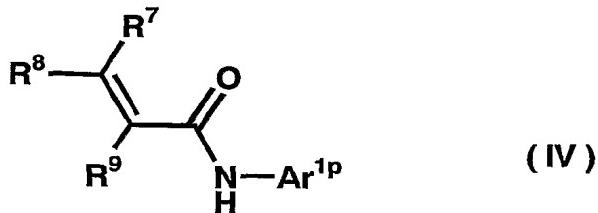


[式中、A、Ar^{1p}、n、t、u、v、w、X及びYは前記の意味を有する]で表される化合物とし、所望により保護基を除去することを特徴とする、一般式(I')



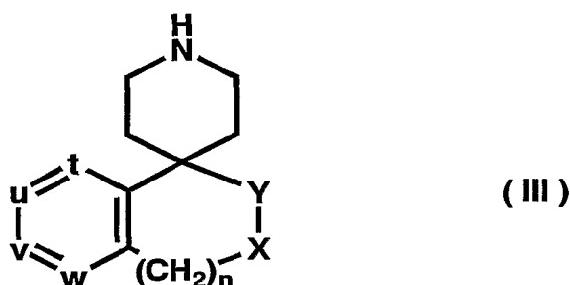
[式中、 Ar^1 はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び $-\text{Q}-\text{Ar}^2$ で表される基からなる群より選択される置換基を有してもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； Ar^2 はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有してもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； Q は単結合又はカルボニル基を意味し； T 、 U 、 V 及び W は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有してもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味し、 A 、 n 、 X 及び Y は前記の意味を有する]で表される化合物、その塩又はエステルの製造法。

(16) 一般式 (IV)

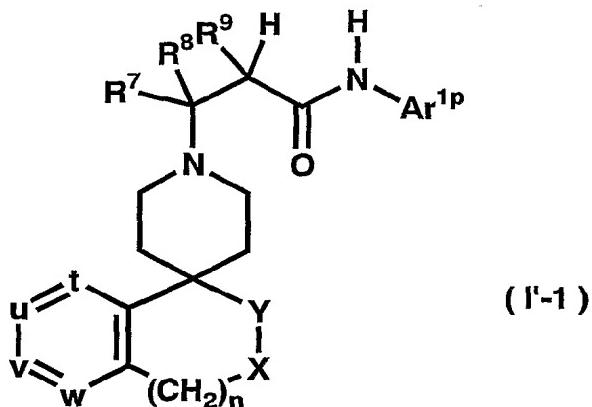


[式中、 Ar^{1p} はハロゲン原子、ニトロ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アル

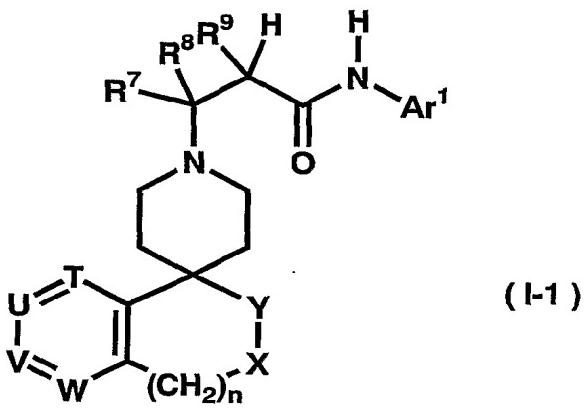
ルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び $-Q^p-Ar^{2p}$ で表される基並びに保護されていてもよい、オキソ基、ヒドロキシ低級アルキル基及びカルボキシリ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； Ar^{2p} はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基並びに保護されていてもよい、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基及び低級アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； Q^p は単結合又は保護されていてもよいカルボニル基を意味し； R^7 、 R^8 及び R^9 は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基又はアラルキル基を意味する]で表される化合物と、一般式(II-I)



[式中、 n は0又は1を意味し； R^1 は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し； R^2 及び R^5 は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し； R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し； t 、 u 、 v 及び w は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基及び低級アルコキシ基並びに保護されていてもよい水酸基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味し； X は $-N(SO_2R^1)-$ 、 $-N(COR^2)-$ 又は $-CO-$ で表される基を意味し； Y は $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-O-$ 又は $-N(R^5)-$ で表される基を意味する]で表される化合物とを反応させ、一般式(I'-1)



[式中、 Ar^{1p} 、n、 R^7 、 R^8 、 R^9 、t、u、v、w、X及びYは前記の意味を有する]で表される化合物とし、所望により保護基を除去することを特徴とする、一般式(I-1)

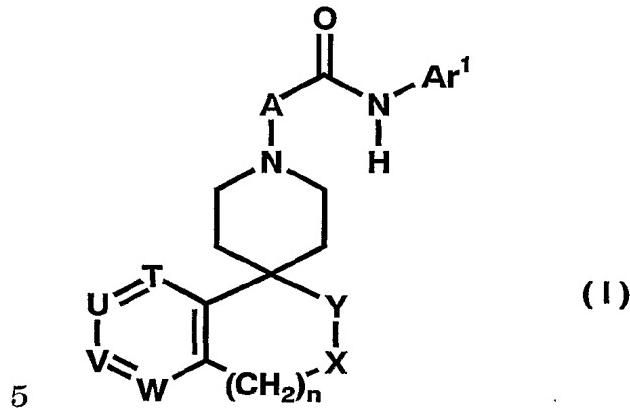


5

[式中、 Ar^1 はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシリル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有してもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； Ar^2 はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有してもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を

有していてもよいメチル基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチル基を意味し、n、R⁷、R⁸、R⁹、X及びYは前記の意味を有する]で表される化合物、その塩又はエステルの製造法。

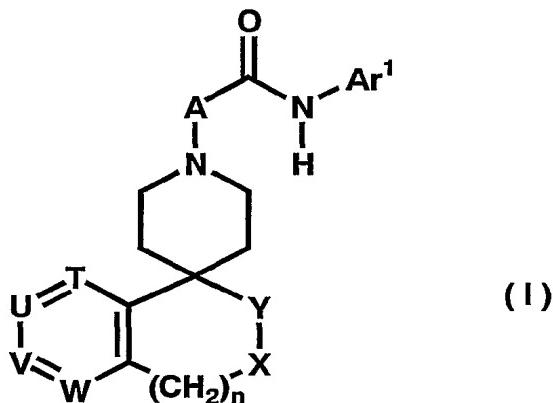
(17) 一般式 (I)



[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；nは0又は1を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R¹は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R²及びR⁵は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R³及びR⁴は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい

メチル基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチル基を意味し；Xは $-N(SO_2R^1)$ 、 $-N(COR^2)$ 、又は $-CO-$ で表される基を意味し；Yは $-C(R^3)(R^4)$ 、 $-O-$ 又は $-N(R^5)$ で表される基を意味する]で表される化合物、その塩又はエステルを有効成分とする神経ペプチドY受容体拮抗剤。

(18) 一般式(I)



[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar¹はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキカルボニル基及び-Q-Ar²で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar²はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；nは0又は1を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R¹は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R²及びR⁵は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R³及びR⁴は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し

；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチル基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチル基を意味し；Xは $-N(SO_2R^1)$ －、 $-N(COR^2)$ －又は $-CO-$ で表される基を意味し；Yは $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-O-$ 又は $-N(R^5)-$ で表される基を意味する】で表される化合物、その塩又はエステルを有効成分とする過食症、肥満症又は糖尿病の処置剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/04954

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D471/10, 471/20, 491/107, 491/20, 519/00, A61K31/438, 31/444, 31/4709, 31/4747, 31/497, 31/506, A61P1/00, 3/04, 3/06, 3/10, 5/00, 9/00, 9/10, 9/12, 9/14, 11/00, 13/12, 15/00, 25/00, 25/04,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D471/10, 471/20, 491/107, 491/20, 519/00, A61K31/438, 31/444, 31/4709, 31/4747, 31/497, 31/506

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| Y | WO 01/14376 A1 (Banyu Pharmaceutical Co., Ltd.), 01 March, 2001 (01.03.01), Claims & JP 2002-030086 A & AU 200064762 A & US 2002/0052371 A1 & US 6326375 B1 & US 6335345 B1 & BR 200013423 A & NO 200200814 A & US 6388077 B1 & EP 1204663 A1 | 1-18 |
| Y | WO 00/27845 A1 (Merck & Co., Inc., Banyu Pharmaceutical Co., Ltd.), 18 March, 2000 (18.03.00), Claims & AU 200014732 A & US 2002/0058813 A1 & US 6313298 B1 & EP 1129089 A1 | 1-18 |

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

| | |
|---|--|
| * Special categories of cited documents: | |
| "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance | "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention |
| "E" earlier document but published on or after the international filing date | "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone |
| "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) | "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art |
| "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means | "&" document member of the same patent family |
| "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed | |

| | |
|---|---|
| Date of the actual completion of the international search 26 August, 2002 (26.08.02) | Date of mailing of the international search report 10 September, 2002 (10.09.02) |
| Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office | Authorized officer |
| Facsimile No. | Telephone No. |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/04954

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| Y A | WO 99/64002 A1 (Merck & Co., Inc.), 16 December, 1999 (16.12.99), & AU 9946801 A1 & US 6294534 B1 & JP 2002-517444 A & US 2001/029259 A1 & US 6410548 B2 | 1-16, 18 17 |
| Y A | WO 99/29696 A1 (F. Hoffmann-La Roche), 17 June, 1999 (17.06.99), Claims 1, 11 & ZA 9811345 A1 & AU 9921578 A & JP 2001-525414 A & CN 1281459 A & EP 1037892 A1 & BR 9813534 A & US 6166209 A & KR 2001023958 A & MX 2000005605 A1 | 1-16, 18 17 |
| Y A | WO 94/13696 A1 (Merck & Co., Inc.), 23 June, 1994 (23.06.94), Claims; page 49 & US 5578593 A & WO 94/19367 A1 & IL 107836 A1 & EP 662481 A1 & ZA 9309272 A & ZA 9309274 A & JP 07-097367 A & CN 1092767 A & FI 9502862 A & NO 9502294 A | 1-16, 18 17 |
| Y A | WO 94/19367 A1 (Merck & Co., Inc.), 01 September, 1994 (01.09.94), Claims; page 57 & US 5536716 A & WO 94/13696 A1 & PL 176993 B1 & EP 615977 A1 & AU 9352320 A1 & AU 9352321 A1 & ZA 9309272 A & ZA 9309274 A & JP 06-263737 A & CN 1092071 A & FI 9502862 A & FI 9502863 A & NO 9502294 A & NO 9502295 A & US 5652235 A | 1-16, 18 17 |
| Y | WO 01/13917 A1 (Bristol-Myers Squibb Co.), 01 March, 2001 (01.03.01), Claims & US 6348472 B1 & EP 1206262 A1 | 1-17 |
| Y | EP 747378 A1 (Bristol-Myers Squibb Co.), 11 December, 1996 (11.12.96), Claims & US 5554621 A & CA 2178414 A & AU 9654755 A1 & JP 09-012572 A | 1-17 |
| P, Y | WO 02/48152 A1 (Neurogen Corp.), 20 June, 2002 (20.06.02), (Family: none) | 1-17 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/04954

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|--|-----------------------|
| A | MALMSTROM, Rickard E. et al., Pharmacology of H 394/84, a dihydropyridine neuropeptide Y Y1 receptor antagonist, <i>in vivo</i> , European Journal of Pharmacology, April, 2001, Vol.418, Nos. 1 to 2, pages 95 to 104 | 1-17 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/04954

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 25/08, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 25/32, 27/06, 29/00, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national
classification and IPC)

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(I P C))

Int. Cl' C07D471/10, 471/20, 491/107, 491/20, 519/00, A61K31/438, 31/444, 31/4709, 31/4747, 31/497, 31/506, A61P1/00, 3/04, 3/06, 3/10, 5/00, 9/00, 9/10, 9/12, 9/14, 11/00, 13/12, 15/00, 25/00, 25/04, 25/08, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 25/32, 27/06, 29/00, 43/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(I P C))

Int. Cl' C07D471/10, 471/20, 491/107, 491/20, 519/00, A61K31/438, 31/444, 31/4709, 31/4747, 31/497, 31/506

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS(STN), CAOLD(STN), REGISTRY(STN), WPI/DS(STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
|-----------------|---|------------------|
| Y | WO 01/14376 A1 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 2001.03.01, claim & JP 2002-030086 A & AU 200064762 A & US 2002/0052371 A1 & US 6326375 B1 & US 6335345 B1 & BR 200013423 A & NO 200200814 A & US 6388077 B1 & EP 1204663 A1 | 1-18 |
| Y | WO 00/27845 A1 (MERCK & CO., INC., BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 2000.03.18, claim & AU 200014732 A & US 2002/0058813 A1 & US 6313298 B1 & EP 1129089 A1 | 1-18 |

C欄の続きにも文献が列挙されている。

パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す)
- 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

2 6 . 0 8 . 0 2

国際調査報告の発送日

1 0 . 0 9 . 0 2

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (I S A / J P)

郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官(権限のある職員)

富永 保



4 P 3 1 2 4

電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 9 2

| C (続き) . 関連すると認められる文献 | | |
|-----------------------|--|------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| Y | WO 99/64002 A1 (MERCK & CO., INC.) 1999.12.16 | 1-16, 18 |
| A | &AU 9946801 A1 &US 6294534 B1 &JP 2002-517444 A &US 2001/029259 A1 &US 6410548 B2 | 17 |
| Y | WO 99/29696 A1 (F. HOFFMANN-LA ROCHE) 1999.06.17, claim1, 11, | 1-16, 18 |
| A | &ZA 9811345 A1 &AU 9921578 A &JP 2001-525414 A &CN 1281459 A &EP 1037892 A1 &BR 9813534 A &US 6166209 A &KR 2001023958 A &MX 2000005605 A1 | 17 |
| Y | WO 94/13696 A1 (MERCK & CO., INC.) 1994.06.23, claim, p49 | 1-16, 18 |
| A | &US 5578593 A &WO 94/19367 A1 &IL 107836 A1 &EP 662481 A1 &ZA 9309272 A &ZA 9309274 A &JP 07-097367 A &CN 1092767 A &F I 9502862 A &NO 9502294 A | 17 |
| Y | WO 94/19367 A1 (MERCK & CO., INC.) 1994.09.01, claim, p57 | 1-16, 18 |
| A | &US 5536716 A &WO 94/13696 A1 &PL 176993 B1 &EP 615977 A1 &AU 9352320 A1 &AU 9352321 A1 &ZA 9309272 A &ZA 9309274 A &JP 06-263737 A &CN 1092071 A & FI 9502862 A &FI 9502863 A & NO 9502294 A &NO 9502295 A &US 5652235 A | 17 |
| Y | WO 01/13917 A1(Bristol-Myers Squibb Company) 2001.03.01, claim他 &US 6348472 B1 &EP 1206262 A1 | 1-17 |
| Y | EP 747378 A1(Bristol-Myers Squibb Company) 1996.12.11, claim他 &US 5554621 A &CA 2178414 A &AU 9654755 A1 &JP 09-012572 A | 1-17 |
| PY | WO 02/48152 A1(Neurogen Corporation) 2002.06.20 (ファミリーなし) | 1-17 |
| A | MALMSTROM, Rickard E. 他, Pharmacology of H 394/84, a dihydropyridine neuropeptide Y Y1 receptor antagonist, in vivo, European Journal of Pharmacology, April 2001, Vol. 418, No. 1-2, pages 95-104 | 1-17 |